

PCT

特許協力条約に基づいて公開された国際出願



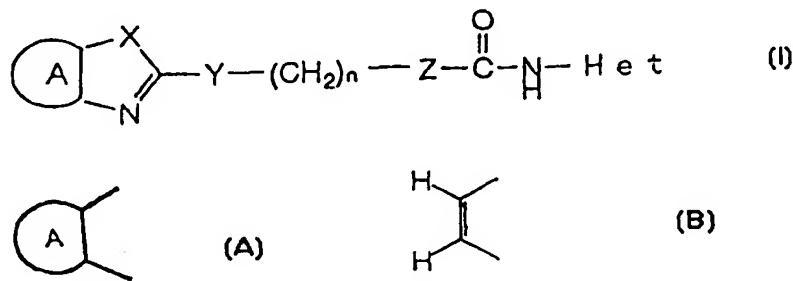
(51) 国際特許分類6 C07D 403/12, 413/12, 417/12, A61K 31/44, 31/505	A1	(11) 国際公開番号 WO99/25712 (43) 国際公開日 1999年5月27日(27.05.99)
(21) 国際出願番号 PCT/JP98/05149 (22) 国際出願日 1998年11月16日(16.11.98) (30) 優先権データ 特願平9/330877 1997年11月14日(14.11.97) JP (71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 興和株式会社(KOWA COMPANY, LTD.)(JP/JP) 〒460-8625 愛知県名古屋市中区錦三丁目6番29号 Aichi, (JP) (72) 発明者: および (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 渋谷公幸(SHIBUYA, Kimiyuki)(JP/JP) 〒359-1142 埼玉県所沢市大字上新井729番地の1 ライオンズビルズ西所沢403号 Saitama, (JP) 三浦 徹(MIURA, Toru)(JP/JP) 〒331-0062 埼玉県大宮市土屋436-15 Saitama, (JP) 川峯勝巳(KAWAMINE, Katsumi)(JP/JP) 佐藤幸広(SATO, Yukihiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43 興和東村山棗 Tokyo, (JP) 鶴谷忠明(OHGIYA, Tadaaki)(JP/JP) 〒359-0038 埼玉県所沢市北秋津96-1-106 Saitama, (JP) 北村崇博(KITAMURA, Takahiro)(JP/JP) 〒189-0022 東京都東村山市野口町2-17-43	興和東村山棗202号 Tokyo, (JP) 尾崎千代香(OZAKI, Chiyoko)(JP/JP) 〒177-0045 東京都練馬区石神井台6-19-42 Tokyo, (JP) 枝野敏行(EDANO, Toshiyuki)(JP/JP) 〒350-1124 埼玉県川越市新宿町2-4-3 板谷川越パークハイツ304号 Saitama, (JP) 平田光輝(HIRATA, Mitsuteru)(JP/JP) 〒350-2211 埼玉県鶴ヶ島市脚折町2-27-19 Saitama, (JP) (74) 代理人 弁理士 佐伯憲生(SAEKI, Norio) 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目15番2号 高愛ビル9階 Tokyo, (JP) (81) 指定国 AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ヨーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	

(54) Title: NOVEL AMIDE COMPOUNDS AND DRUGS CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称 新規アミド化合物及びこれを含有する医薬

(57) Abstract

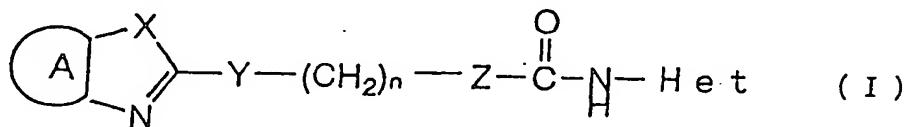
Novel compounds having an ACAT inhibitory effect. Specifically, compounds represented by general formula (I) or salts or solvates thereof and medicinal compositions containing at least one of these compounds, wherein (A) represents a divalent residue of optionally substituted benzene, pyridine, cyclohexane or naphthalene, or (B); HET represents an optionally substituted, monocyclic, polycyclic or fused 5- to 8-membered heterocycle; X represents -NH-, oxygen or sulfur; Y represents -NR4-, oxygen, sulfur, sulfoxide or sulfone; Z represents a single bond or -NRS- (R4 and R5 representing each a specific group); and n is an integer of 1 to 15.



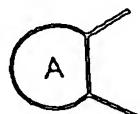
(57)要約

本発明は、新規な A C A T 阻害活性を有する化合物を提供する。

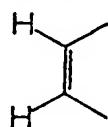
本発明は、一般式 (I)



(式中、



は、置換基を有してもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの
2価残基、又は基



を示し、

H E T は、5～8員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を、X
は-NH-、酸素原子又は硫黄原子を、Yは-NR4-、酸素原子、硫黄原子スルホキ
シド、又はスルホンを、Zは単結合又は-NR5-を、R4、R5は特定の基をそれぞ
れ示し、nは1乃至15の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物、及びこれらの化合物の少なくとも1種を含有してなる医薬組成物に関する。

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

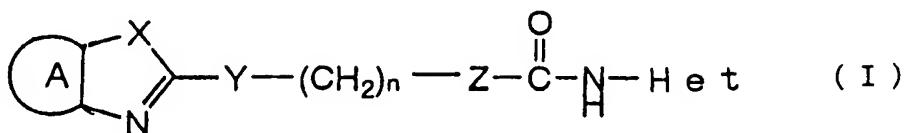
A E	アラブ首長国連邦	E S	スペイン	L I	リヒテンシュタイン	S G	シンガポール
A L	アルバニア	F I	フィンランド	L K	スリ・ランカ	S I	スロヴェニア
A M	アルメニア	F R	フランス	L R	リベリア	S K	スロヴァキア
A T	オーストリア	G A	ガボン	L S	レソト	S L	シェラ・レオネ
A U	オーストラリア	G B	英国	L T	リトアニア	S N	セネガル
A Z	オセルバイジャン	G D	グレナダ	L U	ルクセンブルグ	S Z	スワジランド
B A	ボズニア・ヘルツェゴビナ	G E	グルジア	L V	ラトヴィア	T D	チャード
B B	バルバドス	G H	ガーナ	M C	モナコ	T G	トーゴー
B E	ベルギー	G M	ガンビア	M D	モルドバ	T J	タジキスタン
B F	ブルガリア・ファン	G N	ギニア	M G	マダガスカル	T M	トルクメニスタン
B G	ブルガリア	G W	ギニア・ビサオ	M K	マケドニア旧ユーゴスラヴィア	T R	トルコ
B J	ベナン	G R	ギリシャ	M L	共和国	T T	トリニダッド・トバゴ
B R	ブラジル	H R	クロアチア	M N	マリ	U A	ウクライナ
B Y	ベラルーシ	H U	ハンガリー	M R	モンゴル	U G	ウガンダ
C A	カナダ	I D	インドネシア	M W	モーリタニア	U S	米国
C F	中央アフリカ	I E	アイルランド	M X	マラウイ	U Z	ウズベキスタン
C G	コンゴー	I L	イスラエル	N E	メキシコ	V N	ヴィエトナム
C H	スイス	I N	インド	N L	ニジエール	Y U	ユーロースラビア
C I	コートジボアール	I S	アイスランド	N O	オランダ	Z A	南アフリカ共和国
C M	カメルーン	I T	イタリア	N Z	ノルウェー	Z W	ジンバブエ
C N	中国	J P	日本	P L	ニュージーランド		
C U	キューバ	K E	ケニア	P T	ポーランド		
C Y	キプロス	K G	キルギスタン	R O	ポルトガル		
C Z	チェコ	K P	北朝鮮	R U	ルーマニア		
D E	ドイツ	K R	韓国	S D	ロシア		
D K	デンマーク	K Z	カザフスタン	S E	スコットランド		
E E	エストニア	L C	セントルシア		スウェーデン		

明細書

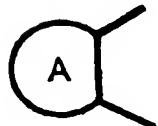
新規アミド化合物及びこれを含有する医薬

技術分野

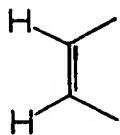
本発明は、新規アミド化合物及びこれを含有する医薬に関する。詳細には、一般式(I)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又は、ナフタレンの2価残基、又は、基



を示し、

Hetは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5~8員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を示し、

Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、-NR+-、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Zは、単結合又は $-NR_s-$ を示し、

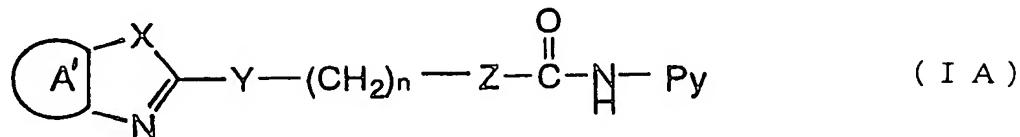
R_sは、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_sは、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

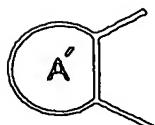
nは、1乃至15の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物に関する。

より詳細には、本発明は、下記の一般式(I A)、



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン又はピリジンの2価残基を示し、

Pyは、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、

Xは、 $-NH-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、 $-NR_s-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Zは、単結合又は $-NR_s-$ を示し、

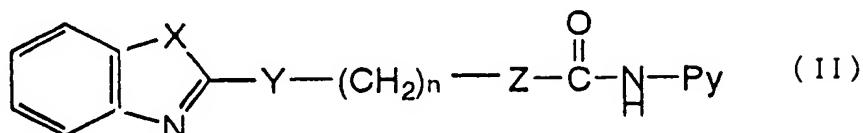
R_sは、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_sは、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよい

シリル低級アルキル基を示し、
 nは、1乃至15の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物に関する。

さらに詳細には、本発明は、下記の一般式(II)



(式中、Xは-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、
 Yは、-NR₄-、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、
 Zは単結合又は-NR₅-を示し、
 R₄は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、
 R₅は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、
 Pyは、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、
 nは、1乃至15の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物に関する。

背景技術

近年、生活水準の向上に基づく高カロリー、高コレステロールを含む欧米型食生活への変化ならびに人口の高齢化に伴い、高脂血症およびこれに起因する動脈硬化性疾患が急増してきており、これが一つの社会問題を呈している。これまでの高脂血症および動脈硬化症の薬物療法は主として原因となる血中の脂質を低下させることに重点が置かれており、動脈硬化病巣そのものを標的として治療するものではなかった。アシル コエンザイムA コレステロール アシルトランス

フェラーゼ（A C A T）はコレステロールからコレステロールエステルへの合成を触媒する酵素であり、コレステロールの代謝と消化管での吸収に重要な役割を果たすものである。小腸上皮細胞において遊離コレステロールのエステル化を行うA C A T酵素を阻害することは腸管からのコレステロールの吸収を阻害し、また、肝臓においてはA C A T阻害に基づくコレステロールエステルの生成阻害が肝臓から血中へのV L D Lの分泌を抑制し、これらの結果により血中コレステロールの低下作用へとつながると考えられる。これまでのA C A T阻害剤の多くはこれら小腸、肝臓のA C A T酵素に作用させ、抗高脂血症剤として血中コレステロールの低下作用を期待するものであった。

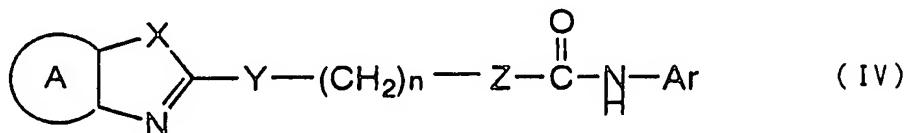
例えば、米国特許第4, 716, 175号明細書には2, 2-ジメチル-N-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)ドデカンアミドが、また、ヨーロッパ特許第372, 445号公報にはN'-(2, 4-ジフルオロフェニル)-N-[5-(4, 5-ジフェニル-1H-イミダゾール-2-イルチオ)ペンチル]-N-ヘプチルウレアなどがA C A T阻害剤として記載されている。しかしながら、これまでの多くのA C A T阻害剤は抗高脂血症剤として血中コレステロールの低下作用に重点を置き、その作用発現のための大量投与から臨床試験の段階で腸管出血、腸管障害、下痢や肝障害などの副作用が多発し、臨床開発を困難にしてきている。

そもそも動脈硬化症は血管の内膜肥厚と脂質蓄積という特徴的な病変であるが、最近の研究によると動脈硬化病巣の形成に中心的な役割を果たしているマクロファージの泡沫化を抑えることが動脈硬化病巣そのものの退縮が期待できるとされている。粥状動脈硬化症の病巣にマクロファージ由来の泡沫細胞（コレステロールエステルを脂肪滴として細胞内に貯蔵している）が観察され、このマクロファージの泡沫化が病変の進展に深く関わっているとされている。また、動脈硬化病変部位の血管壁のA C A T活性が高くなっている、血管壁にコレステロールエステルが蓄積していることが報告されている（ギリーズ、ジェーら、Exp. Mole. Pathol., 44, 329-339 (1986)参照）。

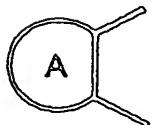
A C A T阻害剤によるコレステロールのエステル化の阻害は細胞内に遊離コレステロールを産みだし、これが高比重リボ蛋白質（H D L）により取り去られ肝

臓に運ばれて (HDLによる逆転送) 代謝されるので病変部位でのコレステロールエステルの蓄積が抑制されることが期待される。この結果、直接的な抗動脈硬化作用が得られると考えられる。ACATには小腸に存在するタイプと血管壁に存在するタイプの二つのサブタイプが存在することが報告されている (キヌーネン, エムら, Biochemistry, 27, 7344-7350, (1988)) が、これまでのACAT阻害剤の研究の多くは小腸、肝臓に存在するタイプの酵素を用いて行われていた (トモダエイチら, J.Antibiotics, 47, 148-153 (1994))。本発明者らは血管壁に存在するタイプのACAT酵素を選択的に阻害する薬剤がより副作用の少ない動脈硬化治療剤に成りうると考え、そのような阻害剤の合成、探索を行った。

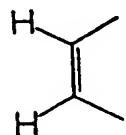
本発明者らは、この目的を達成するため研究を続けた結果、先に一般式 (IV)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は基



を示し、

Ar は、置換基を有していてもよいアリール基を示し、

X は、 $-\text{NH}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、 $-\text{NR}_1-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

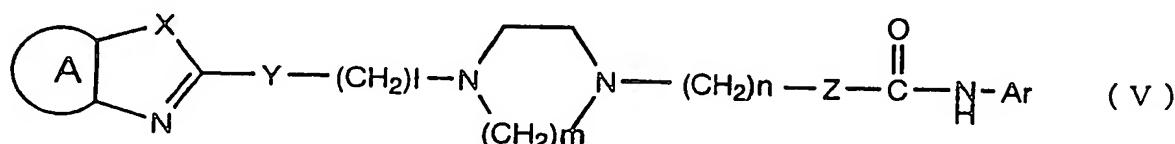
Z は、単結合又は $-\text{NR}_2-$ を示し、

R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

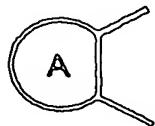
R_5 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

n は、0乃至15の整数を示す。)

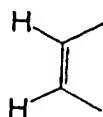
で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物、及び、一般式(V)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は基



を示し、

Ar は、置換基を有していてもよいアリール基を示し、

X は、 $-\text{NH}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、 $-\text{NR}_4-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は $-\text{NR}_5-$ を示し、

R_4 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R_sは、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

lは、0乃至15の整数を示し、

mは、2又は3の整数を示し、

nは、0乃至3の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物が優れたA C A T阻害作用を有することを見出し、特許出願してきた（特願平9—88660号、同9—90146号及び同9—149892号）。

また、前記式(I)で表される化合物に類似した化合物としては、3-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-(フェニル)プロパナミドが、J. Chem. Eng. Data, 27, 207 (1982) に、3-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(フェニル)プロパナミドが、Fungitsidy, Ed. Melnikov, N. N. Izd. Fan Uzb. SSR: Tashkeni, USSR. 82-88 (1980) に開示されている。しかしながら、これらの化合物はいずれもアミド部分がフェニル基である化合物であるばかりでなく、A C A T阻害作用を有することは全く開示されていない。

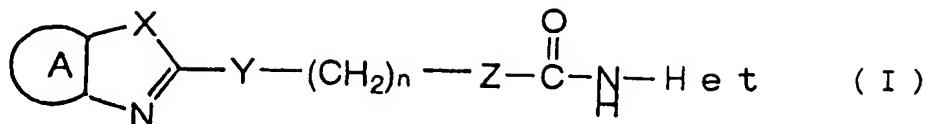
このように、本発明者らは、これらの式(IV)又は式(V)で表される化合物が臓器選択性的A C A T阻害作用及び細胞内コレステロール輸送阻害作用を有し、血中コレステロール低下作用を有する抗高脂血症剤として、さらにマクロファージ泡沫化抑制作用を有する動脈硬化症などの予防、治療剤として有用な化合物であることを見出してきた。

しかしながら、これらの式(IV)又は式(V)で表される化合物はその作用が必ずしも十分なものではなく、また、臓器選択性についても満足なものではなかった。

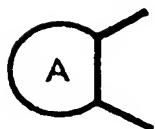
そこで、本発明者等は、さらに優れたA C A T阻害作用を有するA C A T阻害剤の開発をすべく、更に研究を行なった結果、前記一般式(I)で表される化合物が上記欠点を克服した有用なA C A T阻害剤であることを見出し、本発明を完成了。

発明の開示

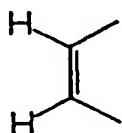
本発明は、前記一般式（I）



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は、基



を示し、

*H e t*は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5～8員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を示し、

Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、-NR₄₊、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Zは、単結合又は-NR₅₋を示し、

R₄は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R₅は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

nは、1乃至15の整数を示す。)

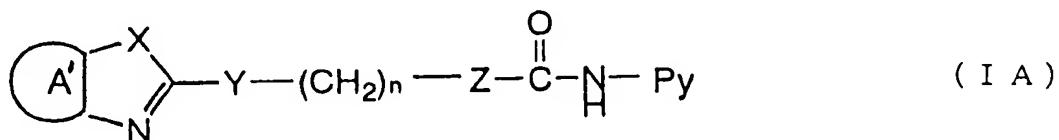
で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物を提供するものである。

また、本発明は、治療上有効な量の前記一般式（I）で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物の少なくとも1種、及び、製薬上許容される担体を含有してなる医薬組成物を提供するものである。

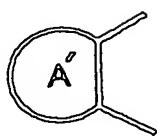
さらに、本発明は、治療上有効な量の前記一般式（I）で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物の少なくとも1種、及び、製薬上許容される担体を含有してなるACAT阻害剤、細胞内コレステロール輸送阻害剤、血中コレステロール低下剤、又は、マクロファージ泡沫化抑制剤を提供するものである。すなわち、本発明は、治療上有効な量の前記一般式（I）で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物の少なくとも1種、及び、製薬上許容される担体を含有してなる、高脂血症、動脈硬化症、頸部及び脳動脈硬化症、脳血管障害、虚血性心疾患、冠状動脈硬化症、腎硬化症、動脈硬化性腎硬化症、細動脈硬化性腎硬化症、悪性腎硬化症、虚血性腸疾患、急性腸管膜血管閉塞症、慢性腸管アンギーナ、虚血性大腸炎、大動脈瘤、閉塞性動脈硬化症（ASO）などの疾患の治療、予防剤を提供し、これらの予防、治療剤を用いた予防、治療方法を提供するものである。

発明を実施するための最良の形態

本発明の前記一般式（I）で表される化合物のより好ましいものとしては、次の一般式（IA）、



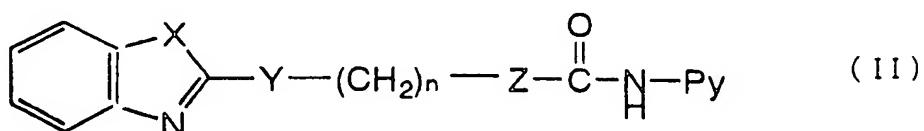
（式中、



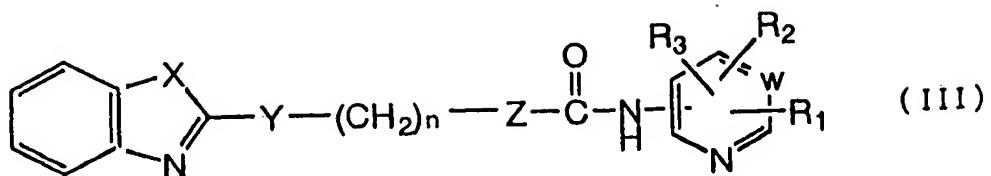
は、置換基を有していてもよいベンゼン又はピリジンの2価残基を示し、
 Pyは、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、
 Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、
 Yは、-NR₄₊、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、
 Zは、単結合又は-NR₃-を示し、
 R₄は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、
 R₅は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、
 nは、1乃至15の整数を示す。)

で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物を挙げることができる。

本発明の前記一般式(I)で表される化合物のさらに好ましいものとしては、
 次の一般式(II)、



(式中、Pyは置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、
 他の置換基は前記の一般式(I)で説明したものと同じものを示す。)
 で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物をあげることができる。
 さらに、本発明の前記一般式(I)で表される化合物のさらに好ましいものと
 しては、次の一般式(III)、



(式中、Wは、基=CH—、又は、基=N—を示し、

R₁、R₂及びR₃は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、水酸基、リン酸基、スルホニアミド基、低級アルキルチオ基、置換基を有していてもよいアミノ基、又は、R₁、R₂、R₃のいずれか2個が一緒になってアルキレンジオキシ基を示す。)

で表される化合物が挙げられる。

本発明の一般式(I)で表される化合物の中の置換基Hetは、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5～8員の置換又は非置換の複素環からなり、当該複素環は単環式であってもよいが、これらの複素環が相互に又は6員芳香環などの炭素環と直接又は炭素鎖等を介して結合した多環式であってもよく、また、これらの複素環が相互に又は6員芳香環などの炭素環と縮合した縮合環式のものであってもよい。これらの複素環の中では、1個又は2個の窒素原子を含有する5～8、好ましくは5～6員の複素環が好ましい。好ましい置換基Hetとしては、例えば、置換又は非置換のピリジル基、置換又は非置換のピリミジル基、置換又は非置換のインドーリル基、置換又は非置換のキノリル基などが挙げられ、置換又は非置換のピリジル基、置換又は非置換のピリミジル基が更に好ましい。

これらの複素環は、非置換のものであってもよいが、1個又は2個以上の置換基を有するものも好ましい。これらの複素環の置換基としては、本発明のACT阻害活性を損なわないものであれば特に制限はないが、低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基、フェニル基又はナフチル基のような置換又は非置換のアリール基、ベンジル基又はフェネチル基のような置換又は非置換のアラルキル基などが好ましい。また、2個の置換基が連結して、

メチレンジオキシ基などのアルキレンジオキシ基となっててもよい。

低級アルキル基としては、炭素数1～10、好ましくは1～6の直鎖状又は分枝鎖状のものが好ましく、例えば、メチル基、エチル基、n-ブロピル基、iso-ブロピル基、n-ブチル基、iso-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基等が特に好ましい。

低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基及び低級アルキルカルボニル基などの低級アルキル基としては、前記のような炭素数1～10、好ましくは1～6の直鎖状又は分枝鎖状の低級アルキル基からなるものが好ましい。例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-ブロボキシ基、iso-ブロボキシ基、n-ブトキシ基、iso-ブトキシ基、tert-ブトキシ基、n-ペンチルオキシ基、n-ヘキシルオキシ基、メチルチオ基、エチルチオ基、n-ブロピルチオ基、iso-ブロピルチオ基、n-ブチルチオ基、iso-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基、メチルカルボニル基、エチルカルボニル基、n-ブロピルカルボニル基、iso-ブロピルカルボニル基、n-ブチルカルボニル基、iso-ブチルカルボニル基、tert-ブチルカルボニル基、n-ペンチルカルボニル基、n-ヘキシルカルボニル基等が挙げられる。

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子等が好ましい。

アリール基としては、炭素数が6～20個、好ましくは6～10個のアリール基であり、当該アリール基は非置換であってもよいが、前記した低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基などで置換されていてもよい。好ましいアリール基としては、フェニル基、ナフチル基、2-メトキシフェニル基、4-メチルチオフェニル基などが挙げられる。

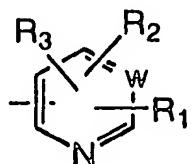
アラルキル基としては、炭素数が7～20個、好ましくは7～12個のアラルキル基であり、当該アラルキル基は非置換であってもよいが、前記した低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基などで置換されていてもよい。好ましいアラルキル基としては、ベンジル基、フェネチル基、

4-メチルベンジル基などが挙げられる。

置換されたアミノ基における置換基としては、前記した低級アルキル基、低級アルキルカルボニル基、アリール基、アラルキル基などが挙げられ、アミノ基の置換基は1個でもよいが2個であってもよい。好ましい置換されたアミノ基としては、メチルアミノ基、エチルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、アセチルアミノ基、ベンジルアミノ基などが挙げられる。

アルキレンジオキシ基のアルキレン基としては、炭素数が1～10個、好ましくは1～5個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキレン基であり、メチレンジオキシ基やエチレンジオキシ基などが好ましい。

好ましいHett基としては、次式(VI)



(式中のW、R₁、R₂及びR₃は、前記したものと示す。)

で表される基が挙げられる。より好ましいHett基としては、

2-メチルチオ-3-ピリジル基、

2-エチルチオ-3-ピリジル基、

2-(iso-プロビルチオ)-3-ピリジル基、

2-メトキシ-3-ピリジル基、

2-クロロ-3-ピリジル基、

2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル基、

2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル基、

2-(iso-プロビルチオ)-4-メチル-3-ピリジル基、

2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル基、

2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル基、

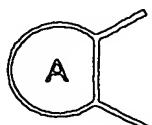
2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル基、

2,6-ビス(iso-プロビルチオ)-3-ピリジル基、

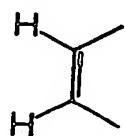
2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル基、
2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル基、
2-(iso-プロピルチオ)-6-メトキシ-3-ピリジル基、
2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル基、
2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル基、
2-(iso-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
2,6-ジメトキシ-3-ピリジル基、
2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、
2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル基、
2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル基、
2-メチル-6-(iso-プロピルチオ)-3-ピリジル基、
2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル基、
2,6-ジメチル-3-ピリジル基、
2,6-ジエチル-3-ピリジル基、
2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
2,4-ビス(iso-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル基、
2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル基、
2,4,6-トリメチル-3-ピリジル基、
4-エチル-2,6-ジメチル-3-ピリジル基、
2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル基、
4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル基、
4,6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル基、
4,6-ビス(iso-プロピルチオ)-5-ピリミジル基、
4,6-ジメトキシ-5-ピリミジル基、
4,6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル基、
4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル基、
4,6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル基、
2,4,6-トリメトキシ-5-ピリミジル基、

4 - メチル - 6 - メチルチオ - 3 - ピリジル基、
 5 - メチルチオ - 2 - ピリジル基、
 2, 4, 6 - トリス (メチルチオ) - 5 - ピリミジル基、
 などを挙げることができる。

本発明の一般式 (I) で表される化合物の中の置換基



は、アゾール環を形成する 2 個の炭素原子と形成されるアゾール環に隣接する 2 価の基を示すものであり、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの 2 価残基、又は、基



が好ましい。より好ましくは置換基を有していてもよいベンゼン又はピリジンの 2 価の残基が挙げられる。これらの 2 価の残基は置換基を有してもよく、当該置換基としては、前記した低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルキルカルボニル基、ハロゲン原子、アミノ基、低級アルキル基などで置換されたアミノ基、フェニル基又はナフチル基のような置換又は非置換のアリール基、ベンジル基又はフェネチル基のような置換又は非置換のアラルキル基などが挙げられる。また、2 個の置換基が連結して、メチレンジオキシ基などのアルキレンジオキシ基となってもよい。

本発明の一般式 (I) で表される化合物中の置換基 X は、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、前記の置換基と一緒にになって、イミダゾール、オキサゾール、又は、チアゾールのアゾール環が形成される。

また、本発明の一般式（I）で表される化合物の中の置換基Yは、 $-NR_4-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、窒素原子の置換基R₄は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示す。置換基R₄の低級アルキル基又はアリール基としては、前記したものであり、例えば、メチル基、エチル基、フェニル基などが挙げられる。置換基R₄における置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基の、低級アルキル基は前記したものでよく、シリル低級アルキル基の置換基としては前記した低級アルキル基、アリール基、アラルキル基などが挙げられ、例えば、トリメチルシリルメチル基、ジメチルフェニルシリルメチル基などが好ましい。

置換基Yの中では、硫黄原子が好ましい。

本発明の一般式（I）で表される化合物の中の置換基Zは、単結合、又は、 $-NR_5-$ を示し、窒素原子の置換基R₅は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、これらの置換基は前記のものと同様である。

本発明の一般式（I）で表される化合物中の繰り返し単位数のnは、1～15の整数、好ましくは1～9の整数を示す。繰り返される単位としては、一般式（I）では、メチレン基を挙げているが、本発明のACAT阻害活性を損なわないのであれば、これらのメチレン基は置換基を有してもよいし、1個又は2個以上のメチレン単位が、窒素原子、酸素原子又は硫黄原子などの異種原子に置き換えられてもよい。

本発明の一般式（II）で表される化合物中の置換基X、Y、Z及び繰り返し単位は前記したものであり、置換基P_yは、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、ピリジル基又はピリミジン基の置換基としては、本発明のACAT阻害活性を損なわないものであれば特に制限はないが、前記一般式（VI）で表されるものが好ましい。

本発明の一般式（III）で表される化合物中の置換基X、Y、Z及び繰り返し単位は前記したものであり、置換基Wは炭素原子又は窒素原子を示し、ピリジン環又はピリミジン環を形成するものである。また、置換基R₁、R₂及びR₃は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、

水酸基、リン酸基、スルホンアミド基、低級アルキルチオ基、置換基を有してもよいアミノ基、又は、R₁、R₂、R₃のいずれか2個が一緒になってアルキレンジオキシ基を示し、これらの基のうちの低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、低級アルキルチオ基、置換基を有してもよいアミノ基、又は、アルキレンジオキシ基は前記したものである。置換基R₁、R₂及びR₃の好ましいものとしては、メチル基、エチル基、iso-ブロピル基、メトキシ基、エトキシ基、iso-ブロボキシ基、塩素、メチルチオ基、エチルチオ基、iso-ブロピルチオ基、ジメチルアミノ基などが挙げられる。また、ピリジン環やピリミジン環の隣接する窒素原子への結合位置も、本発明のACAT阻害活性を損なわない限り特に制限はない。

本発明の一般式(I)、(II)又は(III)で表される化合物の塩としては、本発明のACAT阻害活性を損なわないものであれば特に制限はなく、必要に応じて酸付加塩又は塩基付加塩とすることができます。好ましい酸付加塩としては、例えば、塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の無機酸塩及びメタンスルホン酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、クエン酸塩等の有機酸塩などが挙げられる。

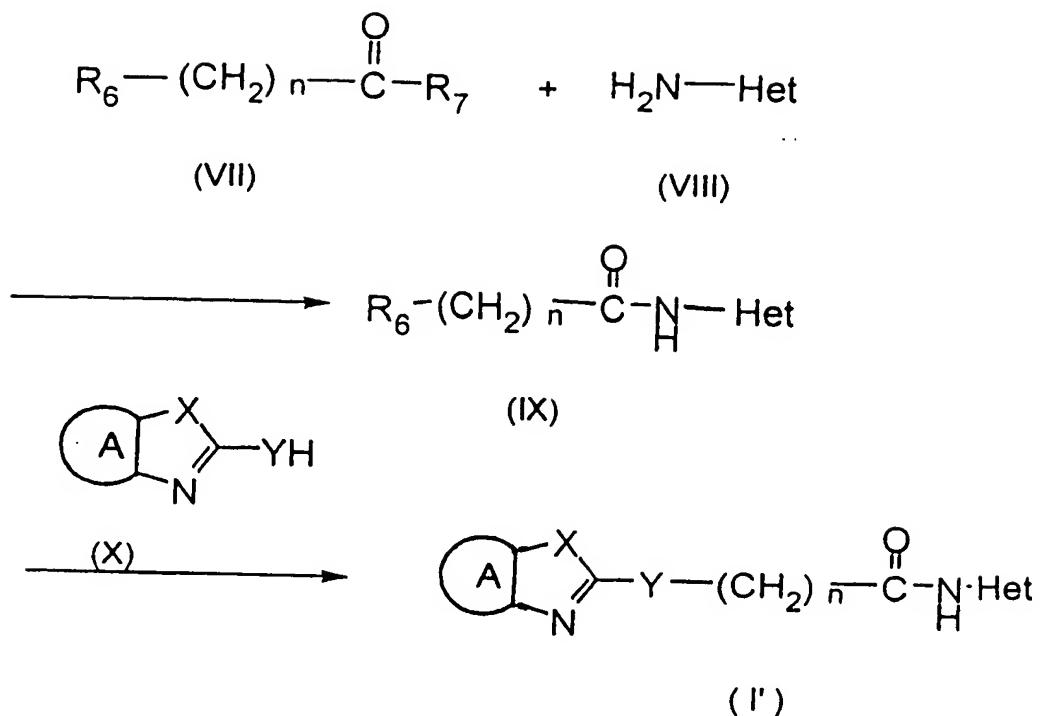
また、本発明の一般式(I)、(II)又は(III)で表される化合物の溶媒和物としては、製造時、精製時などに用いた溶媒、例えば、水、アルコールなどが付加したものであり、ACAT阻害作用などに悪影響を及ぼさないものであれば特に制限されるものではない。溶媒和物としては水和物が好ましい。

次に本発明の化合物の製造方法について説明する。

化合物(I)は種々の公知の方法で製造することができ、特に制限されるものではなく、例えば、次の反応工程に従い製造することができる。

1. 置換基Zが単結合である場合の一般式(I)の化合物の製法。

次に示す反応式に従って、



(式中、R₆は脱離基を、R₇は水酸基又はカルボン酸基の反応性誘導体残基を示す。)

一般式（VII）で示されるカルボン酸又はその反応性誘導体、例えば、酸ハロゲン化物などと、一般式（VIII）で示される複素環式アミンとを反応させて、一般式（IX）で示されるアミド誘導体が得られる。得られた一般式（IX）で示される化合物に、一般式（X）で示されるアゾール誘導体を反応させると、目的の一般式（I）における置換基Zが単結合を示す化合物（I'）を製造することができる。

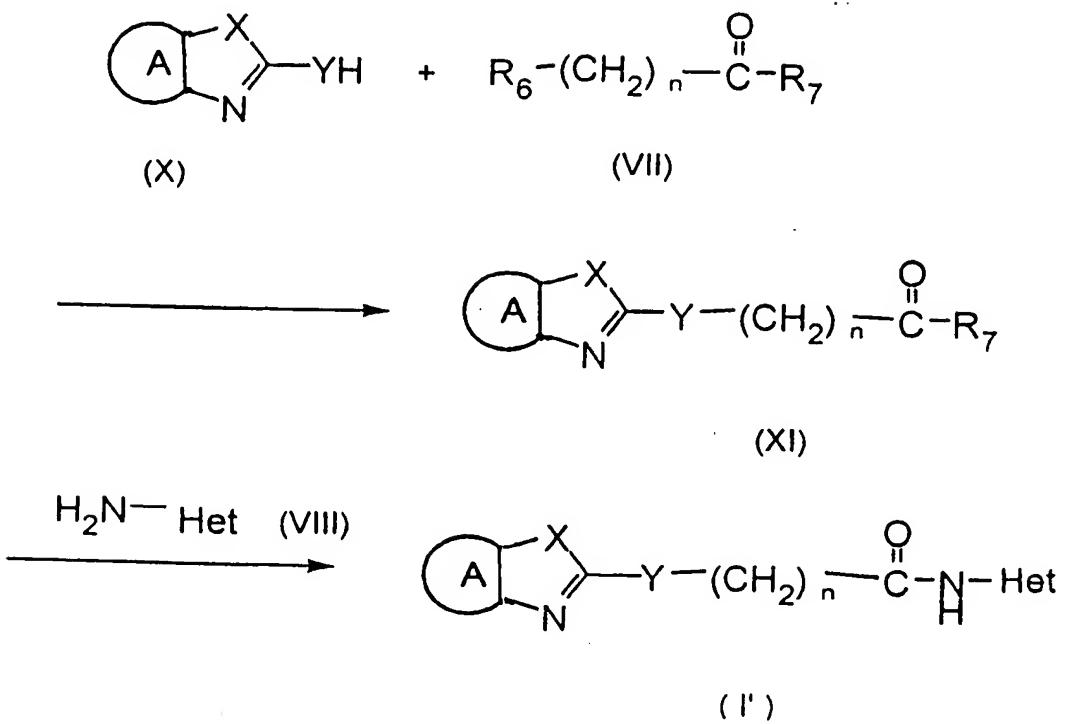
化合物（VII）と化合物（VIII）の反応は、通常のペプチド合成に用いられている方法を適用することができる。一般式（VII）の脱離基R₆としては、例えば、塩素原子、臭素原子などのハロゲン原子などが、R₇の反応性誘導体残基としては、例えば、メシリ酸、トシリ酸、酢酸、ピバロイル酸などとの酸無水物残基などが好ましい。この反応をさらに具体的に説明すれば、縮合剤の存在下に両化合物を溶媒中で反応させることによって目的化合物を得ることができる。縮合剤としては、例えば、1-(3'-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド（WSC）、1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド（DCC）などを単独で使用してもよいが、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール（HOBT）、N-ヒドロキシスクシンイミド（HOSu）などを組み合わせて使用することもできる。溶媒としては、特に制限はないが、例えば、ジメチルホルムアミド、塩化メチレン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、トルエン等を単独または組み合わせて使用することができる。反応は使用する原料によって異なるが、一般には0～100℃、好ましくは室温付近で、1～30時間、好ましくは10～20時間反応させることによって終了する。また、化合物（VII）として、反応性の高いカルボン酸ハロゲン化物を使用するときは、例えば、化合物（VII）と化合物（VIII）とを塩基、例えば、トリエチルアミン、4-ジメチルアミノピリジン、又は、N-メチルモルホリンの存在下に通常の方法で反応させることができる。

出発化合物（VII）及び（VIII）は、例えば、化合物（VII）は、ハロアルキルアルコールをジョーンズ試薬等でカルボン酸に酸化する方法、化合物（VIII）は複素環化合物のニトロ化物を接触還元等の還元反応に付して相当するアミノ複素環式化合物を得る方法などで製造することができる。

上記の方法で得られた化合物（IX）と化合物（X）との反応は溶媒中、塩基の存在下又は非存在下で行うことができる。溶媒としては前記の様なものを使用でき、塩基としては、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の水酸化アルカリ金属類；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の炭酸アルカリ金属類；炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸水素アルカリ金属類などの無機塩基、ピリジン、トリエチルアミン、N,N-ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモ

ルホリン、N、N-ジメチルアニリンなどの有機塩基を使用することができる。

また、目的とする一般式(I')で表される化合物は次式に示す反応、



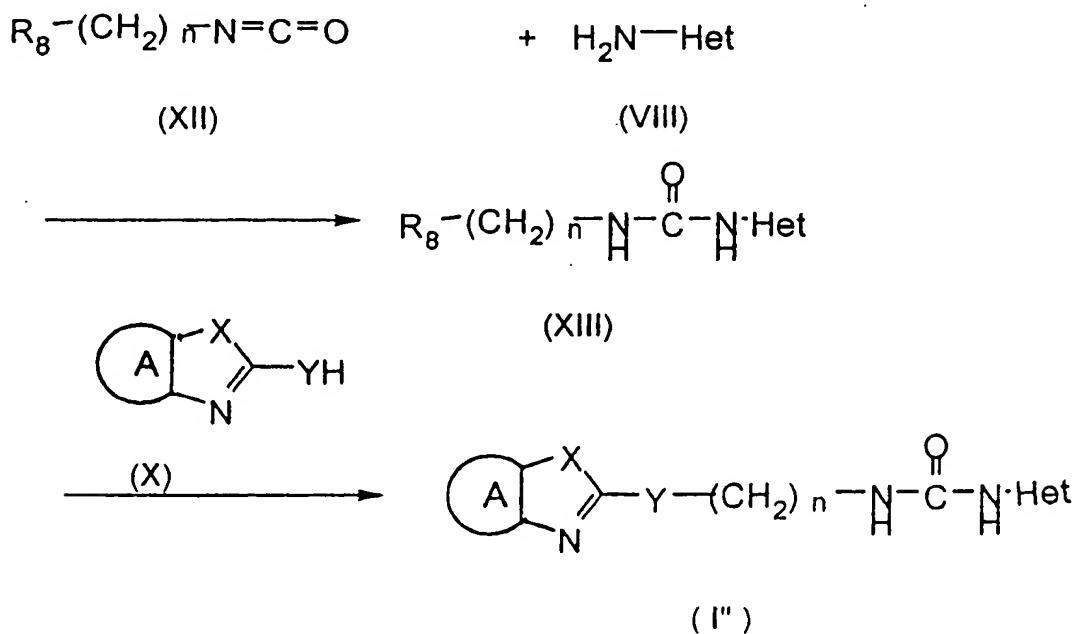
(式中、R₆は脱離基を、R₇は水酸基又はカルボン酸基の反応性誘導体残基を示す。)

に従って、一般式(X)で示されるアゾール誘導体と、一般式(VII)で示される化合物の遊離のカルボン酸又はカルボン酸の不活性体と反応させて、一般式(XI)で示されるカルボン酸誘導体を得る。得られた一般式(XI)で示される化合物又はその反応性誘導体、例えば、酸ハロゲン化物と一般式(VIII)で示される複素環式アミン誘導体とを反応させると、目的の一般式(I')における置換基Zが単結合を示す化合物(I')を製造することができる。

化合物(X)と化合物(VIII)との反応は、前記の反応式の第二工程に準じて行うことができるが、塩基として水酸化カリウム、溶媒としてエタノールを用いる反応が特に好ましい。得られた化合物(XI)と化合物(VIIII)との反応は前記の反応式の第一工程に準じて行うことができる。

2. 置換基Zが-NH-である場合の一般式(I)の化合物の製法。

Zが-NH-を示す場合の一般式(I)で示される化合物は、種々の方法で製造しうるが、次の反応式で示される方法により製造するのが好ましい。



(式中、R₈は、脱離基を示す。)

一般式(XII)で示されるイソシアネート誘導体と一般式(VIIII)で示される複素環式アミンとを反応させることにより、一般式(XIII)で示される尿素誘導体が得られる。得られた尿素誘導体に、化合物(X)を反応させることにより、目的とする一般式(I)における置換基Zが-NH-を示す化合物(I'')が得られる。

この反応式の第一工程の化合物 (XII) と化合物 (VIII)との反応は、化合物 (XII) に対して 1~2 当量の化合物 (VIII) を、溶媒中で反応させることにより化合物 (XIII) が得られる。この際の溶媒としては、特に制限はないが、例えば、塩化メチレン、クロロホルム、エーテル、テトラヒドロフラン、トルエン、キシレン、ジメチルホルムアミドなどを使用することが好ましい。反応は、0℃から用いた溶媒の沸点で、反応時間は 1~24 時間くらいで進行する。

一般式 (XII) で示されるイソシアネート誘導体は公知化合物であり、例えば、前記した化合物 (VIII) のカルボン酸に、塩基の存在下、アジ化ジフェニルホスホリルを反応させる方法（塩入らの方法）、化合物 (VIII) の酸ハロゲン化物とアジ化ナトリウムを反応させ酸アジドを経由する方法などで製造することができる。

化合物 (XIII) と化合物 (X) の反応は、前記した反応式の第二工程に準じて行うことができる。

また、一般式 (I) の置換基 Z が、 $-NR_s-$ (R_s は、前記した定義の水素原子以外の基を示す。) の場合には、適当な段階で窒素原子を置換基 R_s で置換することにより製造することができる。

前記の各反応で得られた中間体および目的化合物は、有機合成化学で常用される精製法、例えば、濾過、抽出、洗浄、乾燥、濃縮、再結晶、各種クロマトグラフィー等に付して単離、精製することができる。また、各中間体は、次の工程に支障がなければ、特に精製することなく次の反応に供することは、当業者にはよく知られていることである。

得られた化合物 (I) は通常の方法で、本発明の塩とすることができます。

また、反応溶媒、再結晶溶媒などの溶媒の溶媒和物、特に水和物とすることも通常の方法により行えることは当業者によく知られていることである。

本発明の方法により得られる一般式 (I)、(II) 又は (III) で表される化合物を次の表 1 から表 78 に例示する。

[表 1]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1		O	S	単結合	1	2-メチルチオ-3-ピリジル
2	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-3-ピリジル
3	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-3-ピリジル
4	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-3-ピリジル
5	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
6	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
7	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-3-ピリジル
8	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-3-ピリジル
9	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-3-ピリジル
10	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-3-ピリジル
11	同上	S	S	単結合	1	2-メチルチオ-3-ピリジル
12	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-3-ピリジル
13	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-3-ピリジル
14	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-3-ピリジル
15	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
16	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
17	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-3-ピリジル
18	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-3-ピリジル
19	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-3-ピリジル
20	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-3-ピリジル

[表 2]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
21		NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-3-ピリジル
22	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-3-ピリジル
23	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-3-ピリジル
24	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-3-ピリジル
25	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
26	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
27	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-3-ピリジル
28	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-3-ピリジル
29	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-3-ピリジル
30	同上	NH	S	単結合	14	2-メチルチオ-3-ピリジル
31	同上	O	S	単結合	1	2-エチルチオ-3-ピリジル
32	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-3-ピリジル
33	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-3-ピリジル
34	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-3-ピリジル
35	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-3-ピリジル
36	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-3-ピリジル
37	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-3-ピリジル
38	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-3-ピリジル
39	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-3-ピリジル
40	同上	O	S	単結合	14	2-エチルチオ-3-ピリジル

[表 3]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
4 1		S	S	単結合	1	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 2	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 3	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 4	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 5	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 6	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 7	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 8	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-3-ピリジル
4 9	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 0	同上	S	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 1	同上	NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 2	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 3	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 4	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 5	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 6	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 7	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 8	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-3-ピリジル
5 9	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-3-ピリジル
6 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-3-ピリジル

[表 4]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
6 1		O	S	単結合	1	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 2	同上	O	S	単結合	2	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 3	同上	O	S	単結合	3	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 4	同上	O	S	単結合	4	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 5	同上	O	S	単結合	5	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 6	同上	O	S	単結合	6	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 7	同上	O	S	単結合	7	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 8	同上	O	S	単結合	8	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
6 9	同上	O	S	単結合	9	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 0	同上	O	S	単結合	1 4	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 1	同上	S	S	単結合	1	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 2	同上	S	S	単結合	2	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 3	同上	S	S	単結合	3	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 4	同上	S	S	単結合	4	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 5	同上	S	S	単結合	5	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 6	同上	S	S	単結合	6	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 7	同上	S	S	単結合	7	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 8	同上	S	S	単結合	8	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
7 9	同上	S	S	単結合	9	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 0	同上	S	S	単結合	1 4	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル

[表5]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
8 1		NH	S	単結合	1	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 2	同上	NH	S	単結合	2	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 3	同上	NH	S	単結合	3	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 4	同上	NH	S	単結合	4	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 5	同上	NH	S	単結合	5	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 6	同上	NH	S	単結合	6	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 7	同上	NH	S	単結合	7	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 8	同上	NH	S	単結合	8	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
8 9	同上	NH	S	単結合	9	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
9 0	同上	NH	S	単結合	1 4	2- (i-プロピルチオ) -3-ピリジル
9 1	同上	O	S	単結合	1	2-メトキシ-3-ピリジル
9 2	同上	O	S	単結合	2	2-メトキシ-3-ピリジル
9 3	同上	O	S	単結合	3	2-メトキシ-3-ピリジル
9 4	同上	O	S	単結合	4	2-メトキシ-3-ピリジル
9 5	同上	O	S	単結合	5	2-メトキシ-3-ピリジル
9 6	同上	O	S	単結合	6	2-メトキシ-3-ピリジル
9 7	同上	O	S	単結合	7	2-メトキシ-3-ピリジル
9 8	同上	O	S	単結合	8	2-メトキシ-3-ピリジル
9 9	同上	O	S	単結合	9	2-メトキシ-3-ピリジル
1 0 0	同上	O	S	単結合	1 4	2-メトキシ-3-ピリジル

[表 6]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
101		S	S	単結合	1	2-メトキシ-3-ピリジル
102	同上	S	S	単結合	2	2-メトキシ-3-ピリジル
103	同上	S	S	単結合	3	2-メトキシ-3-ピリジル
104	同上	S	S	単結合	4	2-メトキシ-3-ピリジル
105	同上	S	S	単結合	5	2-メトキシ-3-ピリジル
106	同上	S	S	単結合	6	2-メトキシ-3-ピリジル
107	同上	S	S	単結合	7	2-メトキシ-3-ピリジル
108	同上	S	S	単結合	8	2-メトキシ-3-ピリジル
109	同上	S	S	単結合	9	2-メトキシ-3-ピリジル
110	同上	S	S	単結合	14	2-メトキシ-3-ピリジル
111	同上	NH	S	単結合	1	2-メトキシ-3-ピリジル
112	同上	NH	S	単結合	2	2-メトキシ-3-ピリジル
113	同上	NH	S	単結合	3	2-メトキシ-3-ピリジル
114	同上	NH	S	単結合	4	2-メトキシ-3-ピリジル
115	同上	NH	S	単結合	5	2-メトキシ-3-ピリジル
116	同上	NH	S	単結合	6	2-メトキシ-3-ピリジル
117	同上	NH	S	単結合	7	2-メトキシ-3-ピリジル
118	同上	NH	S	単結合	8	2-メトキシ-3-ピリジル
119	同上	NH	S	単結合	9	2-メトキシ-3-ピリジル
120	同上	NH	S	単結合	14	2-メトキシ-3-ピリジル

[表7]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
121		O	S	単結合	1	2-クロロ-3-ピリジル
122	同上	O	S	単結合	2	2-クロロ-3-ピリジル
123	同上	O	S	単結合	3	2-クロロ-3-ピリジル
124	同上	O	S	単結合	4	2-クロロ-3-ピリジル
125	同上	O	S	単結合	5	2-クロロ-3-ピリジル
126	同上	O	S	単結合	6	2-クロロ-3-ピリジル
127	同上	O	S	単結合	7	2-クロロ-3-ピリジル
128	同上	O	S	単結合	8	2-クロロ-3-ピリジル
129	同上	O	S	単結合	9	2-クロロ-3-ピリジル
130	同上	O	S	単結合	14	2-クロロ-3-ピリジル
131	同上	S	S	単結合	1	2-クロロ-3-ピリジル
132	同上	S	S	単結合	2	2-クロロ-3-ピリジル
133	同上	S	S	単結合	3	2-クロロ-3-ピリジル
134	同上	S	S	単結合	4	2-クロロ-3-ピリジル
135	同上	S	S	単結合	5	2-クロロ-3-ピリジル
136	同上	S	S	単結合	6	2-クロロ-3-ピリジル
137	同上	S	S	単結合	7	2-クロロ-3-ピリジル
138	同上	S	S	単結合	8	2-クロロ-3-ピリジル
139	同上	S	S	単結合	9	2-クロロ-3-ピリジル
140	同上	S	S	単結合	14	2-クロロ-3-ピリジル

[表 8]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
141		NH	S	単結合	1	2-クロロ-3-ピリジル
142	同上	NH	S	単結合	2	2-クロロ-3-ピリジル
143	同上	NH	S	単結合	3	2-クロロ-3-ピリジル
144	同上	NH	S	単結合	4	2-クロロ-3-ピリジル
145	同上	NH	S	単結合	5	2-クロロ-3-ピリジル
146	同上	NH	S	単結合	6	2-クロロ-3-ピリジル
147	同上	NH	S	単結合	7	2-クロロ-3-ピリジル
148	同上	NH	S	単結合	8	2-クロロ-3-ピリジル
149	同上	NH	S	単結合	9	2-クロロ-3-ピリジル
150	同上	NH	S	単結合	14	2-クロロ-3-ピリジル
151	同上	O	S	単結合	1	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
152	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
153	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
154	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
155	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
156	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
157	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
158	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
159	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
160	同上	O	S	単結合	14	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル

[表 9]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
161		S	S	単結合	1	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
162	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
163	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
164	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
165	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
166	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
167	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
168	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
169	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
170	同上	S	S	単結合	14	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
171	同上	NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
172	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
173	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
174	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
175	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
176	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
177	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
178	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
179	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
180	同上	NH	S	単結合	14	2-メチルチオ-4-メチル-3-ピリジル

[表10]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
181		O	S	単結合	1	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
182	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
183	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
184	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
185	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
186	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
187	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
188	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
189	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
190	同上	O	S	単結合	14	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
191	同上	S	S	単結合	1	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
192	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
193	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
194	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
195	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
196	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
197	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
198	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
199	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
200	同上	S	S	単結合	14	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル

[表11]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
201		NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
202	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
203	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
204	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
205	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
206	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
207	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
208	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
209	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
210	同上	NH	S	単結合	14	2-エチルチオ-4-メチル-3-ピリジル
211	同上	O	S	単結合	1	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
212	同上	O	S	単結合	2	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
213	同上	O	S	単結合	3	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
214	同上	O	S	単結合	4	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
215	同上	O	S	単結合	5	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
216	同上	O	S	単結合	6	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
217	同上	O	S	単結合	7	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
218	同上	O	S	単結合	8	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
219	同上	O	S	単結合	9	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
220	同上	O	S	単結合	14	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル

[表12]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
221		S	S	単結合	1	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
222	同上	S	S	単結合	2	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
223	同上	S	S	単結合	3	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
224	同上	S	S	単結合	4	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
225	同上	S	S	単結合	5	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
226	同上	S	S	単結合	6	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
227	同上	S	S	単結合	7	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
228	同上	S	S	単結合	8	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
229	同上	S	S	単結合	9	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
230	同上	S	S	単結合	14	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
231	同上	NH	S	単結合	1	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
232	同上	NH	S	単結合	2	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
233	同上	NH	S	単結合	3	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
234	同上	NH	S	単結合	4	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
235	同上	NH	S	単結合	5	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
236	同上	NH	S	単結合	6	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
237	同上	NH	S	単結合	7	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
238	同上	NH	S	単結合	8	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
239	同上	NH	S	単結合	9	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル
240	同上	NH	S	単結合	14	2- (i-プロピルチオ) -4-メチル-3-ピリジル

[表13]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
241		O	S	単結合	1	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
242	同上	O	S	単結合	2	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
243	同上	O	S	単結合	3	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
244	同上	O	S	単結合	4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
245	同上	O	S	単結合	5	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
246	同上	O	S	単結合	6	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
247	同上	O	S	単結合	7	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
248	同上	O	S	単結合	8	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
249	同上	O	S	単結合	9	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
250	同上	O	S	単結合	14	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
251	同上	S	S	単結合	1	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
252	同上	S	S	単結合	2	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
253	同上	S	S	単結合	3	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
254	同上	S	S	単結合	4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
255	同上	S	S	単結合	5	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
256	同上	S	S	単結合	6	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
257	同上	S	S	単結合	7	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
258	同上	S	S	単結合	8	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
259	同上	S	S	単結合	9	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
260	同上	S	S	単結合	14	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル

[表14]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
261		NH	S	単結合	1	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
262	同上	NH	S	単結合	2	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
263	同上	NH	S	単結合	3	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
264	同上	NH	S	単結合	4	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
265	同上	NH	S	単結合	5	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
266	同上	NH	S	単結合	6	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
267	同上	NH	S	単結合	7	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
268	同上	NH	S	単結合	8	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
269	同上	NH	S	単結合	9	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
270	同上	NH	S	単結合	14	2-メトキシ-4-メチル-3-ピリジル
271	同上	O	S	単結合	1	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
272	同上	O	S	単結合	2	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
273	同上	O	S	単結合	3	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
274	同上	O	S	単結合	4	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
275	同上	O	S	単結合	5	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
276	同上	O	S	単結合	6	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
277	同上	O	S	単結合	7	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
278	同上	O	S	単結合	8	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
279	同上	O	S	単結合	9	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
280	同上	O	S	単結合	14	2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル

[表15]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
281		S	S	単結合	1	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
282	同上	S	S	単結合	2	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
283	同上	S	S	単結合	3	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
284	同上	S	S	単結合	4	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
285	同上	S	S	単結合	5	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
286	同上	S	S	単結合	6	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
287	同上	S	S	単結合	7	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
288	同上	S	S	単結合	8	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
289	同上	S	S	単結合	9	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
290	同上	S	S	単結合	14	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
291	同上	NH	S	単結合	1	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
292	同上	NH	S	単結合	2	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
293	同上	NH	S	単結合	3	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
294	同上	NH	S	単結合	4	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
295	同上	NH	S	単結合	5	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
296	同上	NH	S	単結合	6	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
297	同上	NH	S	単結合	7	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
298	同上	NH	S	単結合	8	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
299	同上	NH	S	単結合	9	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル
300	同上	NH	S	単結合	14	2, 6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル

【表16】

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
301		O	S	単結合	1	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
302	同上	O	S	単結合	2	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
303	同上	O	S	単結合	3	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
304	同上	O	S	単結合	4	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
305	同上	O	S	単結合	5	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
306	同上	O	S	単結合	6	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
307	同上	O	S	単結合	7	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
308	同上	O	S	単結合	8	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
309	同上	O	S	単結合	9	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
310	同上	O	S	単結合	14	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
311	同上	S	S	単結合	1	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
312	同上	S	S	単結合	2	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
313	同上	S	S	単結合	3	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
314	同上	S	S	単結合	4	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
315	同上	S	S	単結合	5	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
316	同上	S	S	単結合	6	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
317	同上	S	S	単結合	7	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
318	同上	S	S	単結合	8	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
319	同上	S	S	単結合	9	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
320	同上	S	S	単結合	14	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル

[表17]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
321		NH	S	単結合	1	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
322	同上	NH	S	単結合	2	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
323	同上	NH	S	単結合	3	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
324	同上	NH	S	単結合	4	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
325	同上	NH	S	単結合	5	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
326	同上	NH	S	単結合	6	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
327	同上	NH	S	単結合	7	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
328	同上	NH	S	単結合	8	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
329	同上	NH	S	単結合	9	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
330	同上	NH	S	単結合	14	2,6-ビス(エチルチオ)-3-ピリジル
331	同上	O	S	単結合	1	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
332	同上	O	S	単結合	2	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
333	同上	O	S	単結合	3	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
334	同上	O	S	単結合	4	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
335	同上	O	S	単結合	5	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
336	同上	O	S	単結合	6	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
337	同上	O	S	単結合	7	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
338	同上	O	S	単結合	8	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
339	同上	O	S	単結合	9	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
340	同上	O	S	単結合	14	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル

[表 18]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
341		S	S	単結合	1	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
342	同上	S	S	単結合	2	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
343	同上	S	S	単結合	3	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
344	同上	S	S	単結合	4	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
345	同上	S	S	単結合	5	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
346	同上	S	S	単結合	6	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
347	同上	S	S	単結合	7	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
348	同上	S	S	単結合	8	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
349	同上	S	S	単結合	9	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
350	同上	S	S	単結合	14	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
351	同上	NH	S	単結合	1	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
352	同上	NH	S	単結合	2	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
353	同上	NH	S	単結合	3	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
354	同上	NH	S	単結合	4	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
355	同上	NH	S	単結合	5	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
356	同上	NH	S	単結合	6	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
357	同上	NH	S	単結合	7	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
358	同上	NH	S	単結合	8	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
359	同上	NH	S	単結合	9	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル
360	同上	NH	S	単結合	14	2,6-ビス(i-プロピルチオ)-3-ピリジル

[表19]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
361		O	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
362	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
363	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
364	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
365	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
366	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
367	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
368	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
369	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
370	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
371	同上	S	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
372	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
373	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
374	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
375	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
376	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
377	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
378	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
379	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
380	同上	S	S	単結合	1 4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

【表20】

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
381		NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
382	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
383	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
384	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
385	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
386	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
387	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
388	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
389	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
390	同上	NH	S	単結合	14	2-メチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
391	同上	O	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
392	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
393	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
394	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
395	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
396	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
397	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
398	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
399	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
400	同上	O	S	単結合	14	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 21]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
401		S	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
402	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
403	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
404	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
405	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
406	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
407	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
408	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
409	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
410	同上	S	S	単結合	14	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
411	同上	NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
412	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
413	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
414	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
415	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
416	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
417	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
418	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
419	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
420	同上	NH	S	単結合	14	2-エチルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 22]

化合物 番号		X	Y	Z	n	H e t
421		O	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
422	同上	O	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
423	同上	O	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
424	同上	O	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
425	同上	O	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
426	同上	O	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
427	同上	O	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
428	同上	O	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
429	同上	O	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
430	同上	O	S	単結合	14	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
431	同上	S	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
432	同上	S	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
433	同上	S	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
434	同上	S	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
435	同上	S	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
436	同上	S	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
437	同上	S	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
438	同上	S	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
439	同上	S	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
440	同上	S	S	単結合	14	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 23]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
441		NH	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
442	同上	NH	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
443	同上	NH	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
444	同上	NH	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
445	同上	NH	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
446	同上	NH	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
447	同上	NH	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
448	同上	NH	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
449	同上	NH	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
450	同上	NH	S	単結合	14	2-i-プロピルチオ-6-メトキシ-3-ピリジル
451	同上	O	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
452	同上	O	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
453	同上	O	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
454	同上	O	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
455	同上	O	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
456	同上	O	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
457	同上	O	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
458	同上	O	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
459	同上	O	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
460	同上	O	S	単結合	14	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 24]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
461		S	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
462	同上	S	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
463	同上	S	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
464	同上	S	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
465	同上	S	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
466	同上	S	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
467	同上	S	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
468	同上	S	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
469	同上	S	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
470	同上	S	S	単結合	14	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
471	同上	NH	S	単結合	1	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
472	同上	NH	S	単結合	2	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
473	同上	NH	S	単結合	3	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
474	同上	NH	S	単結合	4	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
475	同上	NH	S	単結合	5	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
476	同上	NH	S	単結合	6	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
477	同上	NH	S	単結合	7	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
478	同上	NH	S	単結合	8	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
479	同上	NH	S	単結合	9	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
480	同上	NH	S	単結合	14	2-メチルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 25]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
481		O	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
482	同上	O	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
483	同上	O	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
484	同上	O	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
485	同上	O	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
486	同上	O	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
487	同上	O	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
488	同上	O	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
489	同上	O	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
490	同上	O	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
491	同上	S	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
492	同上	S	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
493	同上	S	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
494	同上	S	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
495	同上	S	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
496	同上	S	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
497	同上	S	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
498	同上	S	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
499	同上	S	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
500	同上	S	S	単結合	1 4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表26]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
501		NH	S	単結合	1	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
502	同上	NH	S	単結合	2	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
503	同上	NH	S	単結合	3	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
504	同上	NH	S	単結合	4	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
505	同上	NH	S	単結合	5	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
506	同上	NH	S	単結合	6	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
507	同上	NH	S	単結合	7	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
508	同上	NH	S	単結合	8	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
509	同上	NH	S	単結合	9	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
510	同上	NH	S	単結合	14	2-エチルチオ-6-メチル-3-ピリジル
511	同上	O	S	単結合	1	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
512	同上	O	S	単結合	2	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
513	同上	O	S	単結合	3	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
514	同上	O	S	単結合	4	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
515	同上	O	S	単結合	5	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
516	同上	O	S	単結合	6	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
517	同上	O	S	単結合	7	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
518	同上	O	S	単結合	8	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
519	同上	O	S	単結合	9	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル
520	同上	O	S	単結合	14	2-i-プロビルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 27]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
521		S	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
522	同上	S	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
523	同上	S	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
524	同上	S	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
525	同上	S	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
526	同上	S	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
527	同上	S	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
528	同上	S	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
529	同上	S	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
530	同上	S	S	単結合	14	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
531	同上	NH	S	単結合	1	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
532	同上	NH	S	単結合	2	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
533	同上	NH	S	単結合	3	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
534	同上	NH	S	単結合	4	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
535	同上	NH	S	単結合	5	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
536	同上	NH	S	単結合	6	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
537	同上	NH	S	単結合	7	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
538	同上	NH	S	単結合	8	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
539	同上	NH	S	単結合	9	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル
540	同上	NH	S	単結合	14	2-i-プロピルチオ-6-メチル-3-ピリジル

[表 28]

化合物 番号	A	X	Y	Z	n	H e t
541		O	S	単結合	1	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
542	同上	O	S	単結合	2	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
543	同上	O	S	単結合	3	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
544	同上	O	S	単結合	4	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
545	同上	O	S	単結合	5	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
546	同上	O	S	単結合	6	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
547	同上	O	S	単結合	7	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
548	同上	O	S	単結合	8	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
549	同上	O	S	単結合	9	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
550	同上	O	S	単結合	14	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
551	同上	S	S	単結合	1	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
552	同上	S	S	単結合	2	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
553	同上	S	S	単結合	3	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
554	同上	S	S	単結合	4	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
555	同上	S	S	単結合	5	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
556	同上	S	S	単結合	6	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
557	同上	S	S	単結合	7	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
558	同上	S	S	単結合	8	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
559	同上	S	S	単結合	9	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
560	同上	S	S	単結合	14	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル

[表29]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
561		NH	S	単結合	1	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
562	同上	NH	S	単結合	2	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
563	同上	NH	S	単結合	3	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
564	同上	NH	S	単結合	4	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
565	同上	NH	S	単結合	5	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
566	同上	NH	S	単結合	6	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
567	同上	NH	S	単結合	7	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
568	同上	NH	S	単結合	8	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
569	同上	NH	S	単結合	9	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
570	同上	NH	S	単結合	14	2, 6-ジメトキシ-3-ピリジル
571	同上	O	S	単結合	1	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
572	同上	O	S	単結合	2	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
573	同上	O	S	単結合	3	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
574	同上	O	S	単結合	4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
575	同上	O	S	単結合	5	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
576	同上	O	S	単結合	6	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
577	同上	O	S	単結合	7	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
578	同上	O	S	単結合	8	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
579	同上	O	S	単結合	9	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
580	同上	O	S	単結合	14	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル

[表 30]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
581		S	S	単結合	1	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
582	同上	S	S	単結合	2	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
583	同上	S	S	単結合	3	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
584	同上	S	S	単結合	4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
585	同上	S	S	単結合	5	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
586	同上	S	S	単結合	6	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
587	同上	S	S	単結合	7	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
588	同上	S	S	単結合	8	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
589	同上	S	S	単結合	9	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
590	同上	S	S	単結合	14	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
591	同上	NH	S	単結合	1	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
592	同上	NH	S	単結合	2	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
593	同上	NH	S	単結合	3	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
594	同上	NH	S	単結合	4	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
595	同上	NH	S	単結合	5	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
596	同上	NH	S	単結合	6	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
597	同上	NH	S	単結合	7	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
598	同上	NH	S	単結合	8	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
599	同上	NH	S	単結合	9	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル
600	同上	NH	S	単結合	14	2-メトキシ-6-メチル-3-ピリジル

[表 31]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
601		O	S	単結合	1	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
602	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
603	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
604	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
605	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
606	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
607	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
608	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
609	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
610	同上	O	S	単結合	14	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
611	同上	S	S	単結合	1	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
612	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
613	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
614	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
615	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
616	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
617	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
618	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
619	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
620	同上	S	S	単結合	14	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル

[表 32]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
621		NH	S	単結合	1	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
622	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
623	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
624	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
625	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
626	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
627	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
628	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
629	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
630	同上	NH	S	単結合	1 4	2-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
631	同上	O	S	単結合	1	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
632	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
633	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
634	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
635	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
636	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
637	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
638	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
639	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
640	同上	O	S	単結合	1 4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル

[表 3 3]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
641		S	S	単結合	1	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
642	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
643	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
644	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
645	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
646	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
647	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
648	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
649	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
650	同上	S	S	単結合	14	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
651	同上	NH	S	単結合	1	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
652	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
653	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
654	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
655	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
656	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
657	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
658	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
659	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル
660	同上	NH	S	単結合	14	2-メチル-6-エチルチオ-3-ピリジル

[表 34]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
661		O	S	単結合	1	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
662	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
663	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
664	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
665	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
666	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
667	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
668	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
669	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
670	同上	O	S	単結合	14	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
671	同上	S	S	単結合	1	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
672	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
673	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
674	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
675	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
676	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
677	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
678	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
679	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
680	同上	S	S	単結合	14	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル

[表35]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
681		NH	S	単結合	1	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
682	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
683	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
684	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
685	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
686	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
687	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
688	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
689	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
690	同上	NH	S	単結合	14	2-メチル-6-i-プロピルチオ-3-ピリジル
691	同上	O	S	単結合	1	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
692	同上	O	S	単結合	2	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
693	同上	O	S	単結合	3	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
694	同上	O	S	単結合	4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
695	同上	O	S	単結合	5	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
696	同上	O	S	単結合	6	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
697	同上	O	S	単結合	7	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
698	同上	O	S	単結合	8	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
699	同上	O	S	単結合	9	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
700	同上	O	S	単結合	14	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 3 6]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
701		S	S	単結合	1	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
702	同上	S	S	単結合	2	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
703	同上	S	S	単結合	3	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
704	同上	S	S	単結合	4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
705	同上	S	S	単結合	5	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
706	同上	S	S	単結合	6	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
707	同上	S	S	単結合	7	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
708	同上	S	S	単結合	8	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
709	同上	S	S	単結合	9	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
710	同上	S	S	単結合	14	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
711	同上	NH	S	単結合	1	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
712	同上	NH	S	単結合	2	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
713	同上	NH	S	単結合	3	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
714	同上	NH	S	単結合	4	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
715	同上	NH	S	単結合	5	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
716	同上	NH	S	単結合	6	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
717	同上	NH	S	単結合	7	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
718	同上	NH	S	単結合	8	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
719	同上	NH	S	単結合	9	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル
720	同上	NH	S	単結合	14	2-メチル-6-メトキシ-3-ピリジル

[表 37]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
721		O	S	単結合	1	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
722	同上	O	S	単結合	2	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
723	同上	O	S	単結合	3	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
724	同上	O	S	単結合	4	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
725	同上	O	S	単結合	5	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
726	同上	O	S	単結合	6	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
727	同上	O	S	単結合	7	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
728	同上	O	S	単結合	8	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
729	同上	O	S	単結合	9	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
730	同上	O	S	単結合	14	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
731	同上	S	S	単結合	1	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
732	同上	S	S	単結合	2	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
733	同上	S	S	単結合	3	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
734	同上	S	S	単結合	4	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
735	同上	S	S	単結合	5	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
736	同上	S	S	単結合	6	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
737	同上	S	S	単結合	7	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
738	同上	S	S	単結合	8	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
739	同上	S	S	単結合	9	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
740	同上	S	S	単結合	14	2, 6-ジメチル-3-ピリジル

[表 38]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
741		NH	S	単結合	1	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
742	同上	NH	S	単結合	2	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
743	同上	NH	S	単結合	3	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
744	同上	NH	S	単結合	4	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
745	同上	NH	S	単結合	5	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
746	同上	NH	S	単結合	6	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
747	同上	NH	S	単結合	7	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
748	同上	NH	S	単結合	8	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
749	同上	NH	S	単結合	9	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
750	同上	NH	S	単結合	14	2, 6-ジメチル-3-ピリジル
751	同上	O	S	単結合	1	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
752	同上	O	S	単結合	2	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
753	同上	O	S	単結合	3	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
754	同上	O	S	単結合	4	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
755	同上	O	S	単結合	5	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
756	同上	O	S	単結合	6	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
757	同上	O	S	単結合	7	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
758	同上	O	S	単結合	8	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
759	同上	O	S	単結合	9	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
760	同上	O	S	単結合	14	2, 6-ジエチル-3-ピリジル

[表39]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
761		S	S	単結合	1	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
762	同上	S	S	単結合	2	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
763	同上	S	S	単結合	3	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
764	同上	S	S	単結合	4	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
765	同上	S	S	単結合	5	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
766	同上	S	S	単結合	6	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
767	同上	S	S	単結合	7	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
768	同上	S	S	単結合	8	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
769	同上	S	S	単結合	9	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
770	同上	S	S	単結合	14	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
771	同上	NH	S	単結合	1	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
772	同上	NH	S	単結合	2	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
773	同上	NH	S	単結合	3	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
774	同上	NH	S	単結合	4	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
775	同上	NH	S	単結合	5	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
776	同上	NH	S	単結合	6	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
777	同上	NH	S	単結合	7	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
778	同上	NH	S	単結合	8	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
779	同上	NH	S	単結合	9	2, 6-ジエチル-3-ピリジル
780	同上	NH	S	単結合	14	2, 6-ジエチル-3-ピリジル

[表 40]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
781		O	S	単結合	1	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
782	同上	O	S	単結合	2	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
783	同上	O	S	単結合	3	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
784	同上	O	S	単結合	4	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
785	同上	O	S	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
786	同上	O	S	単結合	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
787	同上	O	S	単結合	7	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
788	同上	O	S	単結合	8	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
789	同上	O	S	単結合	9	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
790	同上	O	S	単結合	14	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
791	同上	S	S	単結合	1	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
792	同上	S	S	単結合	2	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
793	同上	S	S	単結合	3	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
794	同上	S	S	単結合	4	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
795	同上	S	S	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
796	同上	S	S	単結合	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
797	同上	S	S	単結合	7	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
798	同上	S	S	単結合	8	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
799	同上	S	S	単結合	9	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
800	同上	S	S	単結合	14	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル

[表 4 1]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
801		NH	S	単結合	1	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
802	同上	NH	S	単結合	2	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
803	同上	NH	S	単結合	3	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
804	同上	NH	S	単結合	4	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
805	同上	NH	S	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
806	同上	NH	S	単結合	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
807	同上	NH	S	単結合	7	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
808	同上	NH	S	単結合	8	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
809	同上	NH	S	単結合	9	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
810	同上	NH	S	単結合	14	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
811	同上	O	S	単結合	1	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
812	同上	O	S	単結合	2	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
813	同上	O	S	単結合	3	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
814	同上	O	S	単結合	4	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
815	同上	O	S	単結合	5	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
816	同上	O	S	単結合	6	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
817	同上	O	S	単結合	7	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
818	同上	O	S	単結合	8	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
819	同上	O	S	単結合	9	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
820	同上	O	S	単結合	14	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル

【表42】

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
821		S	S	単結合	1	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
822	同上	S	S	単結合	2	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
823	同上	S	S	単結合	3	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
824	同上	S	S	単結合	4	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
825	同上	S	S	単結合	5	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
826	同上	S	S	単結合	6	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
827	同上	S	S	単結合	7	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
828	同上	S	S	単結合	8	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
829	同上	S	S	単結合	9	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
830	同上	S	S	単結合	14	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
831	同上	NH	S	単結合	1	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
832	同上	NH	S	単結合	2	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
833	同上	NH	S	単結合	3	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
834	同上	NH	S	単結合	4	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
835	同上	NH	S	単結合	5	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
836	同上	NH	S	単結合	6	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
837	同上	NH	S	単結合	7	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
838	同上	NH	S	単結合	8	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
839	同上	NH	S	単結合	9	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
840	同上	NH	S	単結合	14	2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル

[表 4 3]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
841		O	S	単結合	1	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
842	同上	O	S	単結合	2	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
843	同上	O	S	単結合	3	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
844	同上	O	S	単結合	4	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
845	同上	O	S	単結合	5	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
846	同上	O	S	単結合	6	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
847	同上	O	S	単結合	7	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
848	同上	O	S	単結合	8	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
849	同上	O	S	単結合	9	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
850	同上	O	S	単結合	14	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
851	同上	S	S	単結合	1	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
852	同上	S	S	単結合	2	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
853	同上	S	S	単結合	3	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
854	同上	S	S	単結合	4	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
855	同上	S	S	単結合	5	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
856	同上	S	S	単結合	6	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
857	同上	S	S	単結合	7	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
858	同上	S	S	単結合	8	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
859	同上	S	S	単結合	9	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル
860	同上	S	S	単結合	14	2, 4-ビス (i-プロピルチオ) -6-メチル-3-ピリジル

[表 44]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
861		NH	S	単結合	1	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
862	同上	NH	S	単結合	2	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
863	同上	NH	S	単結合	3	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
864	同上	NH	S	単結合	4	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
865	同上	NH	S	単結合	5	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
866	同上	NH	S	単結合	6	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
867	同上	NH	S	単結合	7	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
868	同上	NH	S	単結合	8	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
869	同上	NH	S	単結合	9	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
870	同上	NH	S	単結合	14	2,4-ビス(i-プロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
871	同上	O	S	単結合	1	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
872	同上	O	S	単結合	2	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
873	同上	O	S	単結合	3	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
874	同上	O	S	単結合	4	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
875	同上	O	S	単結合	5	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
876	同上	O	S	単結合	6	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
877	同上	O	S	単結合	7	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
878	同上	O	S	単結合	8	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
879	同上	O	S	単結合	9	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
880	同上	O	S	単結合	14	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル

[表 45]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
881		S	S	単結合	1	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
882	同上	S	S	単結合	2	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
883	同上	S	S	単結合	3	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
884	同上	S	S	単結合	4	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
885	同上	S	S	単結合	5	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
886	同上	S	S	単結合	6	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
887	同上	S	S	単結合	7	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
888	同上	S	S	単結合	8	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
889	同上	S	S	単結合	9	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
890	同上	S	S	単結合	14	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
891	同上	NH	S	単結合	1	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
892	同上	NH	S	単結合	2	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
893	同上	NH	S	単結合	3	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
894	同上	NH	S	単結合	4	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
895	同上	NH	S	単結合	5	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
896	同上	NH	S	単結合	6	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
897	同上	NH	S	単結合	7	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
898	同上	NH	S	単結合	8	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
899	同上	NH	S	単結合	9	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル
900	同上	NH	S	単結合	14	2,4-ジメトキシ-6-メチル-3-ピリジル

[表 4 6]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
901		O	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
902	同上	O	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
903	同上	O	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
904	同上	O	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
905	同上	O	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
906	同上	O	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
907	同上	O	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
908	同上	O	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
909	同上	O	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
910	同上	O	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
911	同上	S	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
912	同上	S	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
913	同上	S	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
914	同上	S	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
915	同上	S	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
916	同上	S	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
917	同上	S	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
918	同上	S	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
919	同上	S	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
920	同上	S	S	単結合	1 4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル

[表47]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
921		NH	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
922	同上	NH	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
923	同上	NH	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
924	同上	NH	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
925	同上	NH	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
926	同上	NH	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
927	同上	NH	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
928	同上	NH	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
929	同上	NH	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
930	同上	NH	S	単結合	14	2, 4, 6-トリメチル-3-ピリジル
931	同上	O	S	単結合	1	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
932	同上	O	S	単結合	2	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
933	同上	O	S	単結合	3	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
934	同上	O	S	単結合	4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
935	同上	O	S	単結合	5	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
936	同上	O	S	単結合	6	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
937	同上	O	S	単結合	7	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
938	同上	O	S	単結合	8	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
939	同上	O	S	単結合	9	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
940	同上	O	S	単結合	14	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル

[表48]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
941		S	S	単結合	1	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
942	同上	S	S	単結合	2	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
943	同上	S	S	単結合	3	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
944	同上	S	S	単結合	4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
945	同上	S	S	単結合	5	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
946	同上	S	S	単結合	6	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
947	同上	S	S	単結合	7	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
948	同上	S	S	単結合	8	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
949	同上	S	S	単結合	9	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
950	同上	S	S	単結合	14	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
951	同上	NH	S	単結合	1	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
952	同上	NH	S	単結合	2	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
953	同上	NH	S	単結合	3	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
954	同上	NH	S	単結合	4	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
955	同上	NH	S	単結合	5	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
956	同上	NH	S	単結合	6	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
957	同上	NH	S	単結合	7	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
958	同上	NH	S	単結合	8	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
959	同上	NH	S	単結合	9	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル
960	同上	NH	S	単結合	14	4-エチル-2, 6-ジメチル-3-ピリジル

[表49]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
961		O	S	単結合	1	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
962	同上	O	S	単結合	2	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
963	同上	O	S	単結合	3	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
964	同上	O	S	単結合	4	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
965	同上	O	S	単結合	5	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
966	同上	O	S	単結合	6	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
967	同上	O	S	単結合	7	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
968	同上	O	S	単結合	8	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
969	同上	O	S	単結合	9	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
970	同上	O	S	単結合	14	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
971	同上	S	S	単結合	1	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
972	同上	S	S	単結合	2	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
973	同上	S	S	単結合	3	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
974	同上	S	S	単結合	4	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
975	同上	S	S	単結合	5	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
976	同上	S	S	単結合	6	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
977	同上	S	S	単結合	7	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
978	同上	S	S	単結合	8	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
979	同上	S	S	単結合	9	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
980	同上	S	S	単結合	14	2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル

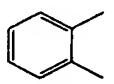
[表50]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
981		NH	S	単結合	1	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
982	同上	NH	S	単結合	2	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
983	同上	NH	S	単結合	3	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
984	同上	NH	S	単結合	4	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
985	同上	NH	S	単結合	5	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
986	同上	NH	S	単結合	6	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
987	同上	NH	S	単結合	7	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
988	同上	NH	S	単結合	8	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
989	同上	NH	S	単結合	9	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
990	同上	NH	S	単結合	14	2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ピリジル
991	同上	O	S	単結合	1	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
992	同上	O	S	単結合	2	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
993	同上	O	S	単結合	3	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
994	同上	O	S	単結合	4	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
995	同上	O	S	単結合	5	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
996	同上	O	S	単結合	6	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
997	同上	O	S	単結合	7	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
998	同上	O	S	単結合	8	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
999	同上	O	S	単結合	9	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1000	同上	O	S	単結合	14	4,6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル

[表 51]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1001		S	S	単結合	1	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1002	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1003	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1004	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1005	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1006	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1007	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1008	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1009	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1010	同上	S	S	単結合	14	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1011	同上	NH	S	単結合	1	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1012	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1013	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1014	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1015	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1016	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1017	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1018	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1019	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1020	同上	NH	S	単結合	14	4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル

[表 52]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1021		O	S	単結合	1	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1022	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1023	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1024	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1025	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1026	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1027	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1028	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1029	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1030	同上	O	S	単結合	14	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1031	同上	S	S	単結合	1	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1032	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1033	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1034	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1035	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1036	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1037	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1038	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1039	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル
1040	同上	S	S	単結合	14	4, 6-ビス(エチルチオ)-5-ピリミジル

[表 5 3]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1041		NH	S	単結合	1	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1042	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1043	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1044	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1045	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1046	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1047	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1048	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1049	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1050	同上	NH	S	単結合	14	4, 6-ビス (エチルチオ) -5-ピリミジル
1051	同上	O	S	単結合	1	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1052	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1053	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1054	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1055	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1056	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1057	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1058	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1059	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル
1060	同上	O	S	単結合	14	4, 6-ビス (i-プロピルチオ) -5-ピリミジル

[表 54]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1061		S	S	単結合	1	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1062	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1063	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1064	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1065	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1066	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1067	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1068	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1069	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1070	同上	S	S	単結合	14	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1071	同上	NH	S	単結合	1	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1072	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1073	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1074	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1075	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1076	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1077	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1078	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1079	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル
1080	同上	NH	S	単結合	14	4, 6-ビス(i-プロピルチオ)-5-ピリミジル

[表 55]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1081		O	S	単結合	1	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1082	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1083	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1084	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1085	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1086	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1087	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1088	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1089	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1090	同上	O	S	単結合	14	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1091	同上	S	S	単結合	1	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1092	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1093	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1094	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1095	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1096	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1097	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1098	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1099	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル
1100	同上	S	S	単結合	14	4, 6-ジメトキシ-5-ピリミジル

[表 5 6]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1101		NH	S	単結合	1	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1102	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1103	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1104	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1105	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1106	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1107	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1108	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1109	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1110	同上	NH	S	単結合	14	4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ピリミジル
1111	同上	O	S	単結合	1	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1112	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1113	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1114	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1115	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1116	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1117	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1118	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1119	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1120	同上	O	S	単結合	14	4, 6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル

[表 5 7]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1121		S	S	単結合	1	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1122	同上	S	S	単結合	2	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1123	同上	S	S	単結合	3	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1124	同上	S	S	単結合	4	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1125	同上	S	S	単結合	5	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1126	同上	S	S	単結合	6	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1127	同上	S	S	単結合	7	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1128	同上	S	S	単結合	8	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1129	同上	S	S	単結合	9	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1130	同上	S	S	単結合	14	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1131	同上	NH	S	単結合	1	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1132	同上	NH	S	単結合	2	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1133	同上	NH	S	単結合	3	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1134	同上	NH	S	単結合	4	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1135	同上	NH	S	単結合	5	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1136	同上	NH	S	単結合	6	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1137	同上	NH	S	単結合	7	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1138	同上	NH	S	単結合	8	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1139	同上	NH	S	単結合	9	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル
1140	同上	NH	S	単結合	14	4,6-ビス(ジメチルアミノ)-5-ピリミジル

[表 58]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1141		O	S	単結合	1	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1142	同上	O	S	単結合	2	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1143	同上	O	S	単結合	3	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1144	同上	O	S	単結合	4	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1145	同上	O	S	単結合	5	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1146	同上	O	S	単結合	6	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1147	同上	O	S	単結合	7	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1148	同上	O	S	単結合	8	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1149	同上	O	S	単結合	9	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1150	同上	O	S	単結合	1 4	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1151	同上	S	S	単結合	1	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1152	同上	S	S	単結合	2	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1153	同上	S	S	単結合	3	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1154	同上	S	S	単結合	4	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1155	同上	S	S	単結合	5	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1156	同上	S	S	単結合	6	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1157	同上	S	S	単結合	7	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1158	同上	S	S	単結合	8	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1159	同上	S	S	単結合	9	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル
1160	同上	S	S	単結合	1 4	4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ピリミジル

[表 5 9]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1161		NH	S	単結合	1	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1162	同上	NH	S	単結合	2	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1163	同上	NH	S	単結合	3	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1164	同上	NH	S	単結合	4	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1165	同上	NH	S	単結合	5	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1166	同上	NH	S	単結合	6	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1167	同上	NH	S	単結合	7	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1168	同上	NH	S	単結合	8	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1169	同上	NH	S	単結合	9	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1170	同上	NH	S	単結合	14	4, 6-ビス (メチルチオ) -2-メチル-5-ピリミジル
1171	同上	O	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1172	同上	O	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1173	同上	O	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1174	同上	O	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1175	同上	O	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1176	同上	O	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1177	同上	O	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1178	同上	O	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1179	同上	O	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1180	同上	O	S	単結合	14	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル

[表60]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1181		S	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1182	同上	S	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1183	同上	S	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1184	同上	S	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1185	同上	S	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1186	同上	S	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1187	同上	S	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1188	同上	S	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1189	同上	S	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1190	同上	S	S	単結合	14	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1191	同上	NH	S	単結合	1	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1192	同上	NH	S	単結合	2	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1193	同上	NH	S	単結合	3	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1194	同上	NH	S	単結合	4	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1195	同上	NH	S	単結合	5	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1196	同上	NH	S	単結合	6	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1197	同上	NH	S	単結合	7	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1198	同上	NH	S	単結合	8	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1199	同上	NH	S	単結合	9	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル
1200	同上	NH	S	単結合	14	2, 4, 6-トリメトキシ-5-ピリミジル

[表 6 1]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1201		O	SO	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1202	同上	O	SO ₂	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1203	同上	O	NH	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1204	同上	S	SO	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1205	同上	S	SO ₂	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1206	同上	S	NH	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1207	同上	NH	SO	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1208	同上	NH	SO ₂	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1209	同上	NH	NH	単結合	5	2-メチルチオ-3-ピリジル
1210	同上	O	SO	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1211	同上	O	SO ₂	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1212	同上	O	NH	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1213	同上	S	SO	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1214	同上	S	SO ₂	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1215	同上	S	NH	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1216	同上	NH	SO	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1217	同上	NH	SO ₂	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル
1218	同上	NH	NH	NH	6	2-メチルチオ-3-ピリジル

[表 6 2]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1219		O	SO	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1220	同上	O	SO ₂	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1221	同上	O	NH	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1222	同上	S	SO	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1223	同上	S	SO ₂	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1224	同上	S	NH	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1225	同上	NH	SO	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1226	同上	NH	SO ₂	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1227	同上	NH	NH	単結合	5	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1228	同上	O	SO	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1229	同上	O	SO ₂	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1230	同上	O	NH	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1231	同上	S	SO	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1232	同上	S	SO ₂	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1233	同上	S	NH	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1234	同上	NH	SO	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1235	同上	NH	SO ₂	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル
1236	同上	NH	NH	NH	6	2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル

[表 6 3]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1237		O	S	単結合	5	
1238		O	S	単結合	5	
1239		O	S	単結合	8	
1240		O	S	単結合	8	
1241		O	S	単結合	5	
1242		O	S	単結合	5	
1243		O	S	単結合	8	
1244		O	S	単結合	8	
1245		S	S	単結合	1	
1246		NH	S	単結合	1	

[表 6 4]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1247		O	S	単結合	1	
1248		O	S	単結合	2	
1249		O	S	単結合	3	
1250		O	S	単結合	4	
1251		O	S	単結合	5	
1252		O	S	単結合	6	
1253		O	S	単結合	7	
1254		O	S	単結合	8	
1255		O	S	単結合	9	
1256		O	S	単結合	14	

[表 6 5]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1 2 5 7		O	S	単結合	1	
1 2 5 8		O	S	単結合	2	
1 2 5 9		O	S	単結合	3	
1 2 6 0		O	S	単結合	4	
1 2 6 1		O	S	単結合	5	
1 2 6 2		O	S	単結合	6	
1 2 6 3		O	S	単結合	7	
1 2 6 4		O	S	単結合	8	
1 2 6 5		O	S	単結合	9	
1 2 6 6		O	S	単結合	1 4	

[表 6 6]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1267		O	S	単結合	1	
1268		O	S	単結合	2	
1269		O	S	単結合	3	
1270		O	S	単結合	4	
1271		O	S	単結合	5	
1272		O	S	単結合	6	
1273		O	S	単結合	7	
1274		O	S	単結合	8	
1275		O	S	単結合	9	
1276		O	S	単結合	14	

[表 6 7]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1277		O	S	単結合	1	
1278		O	S	単結合	2	
1279		O	S	単結合	3	
1280		O	S	単結合	4	
1281		O	S	単結合	5	
1282		O	S	単結合	6	
1283		O	S	単結合	7	
1284		O	S	単結合	8	
1285		O	S	単結合	9	
1286		O	S	単結合	14	

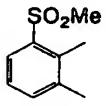
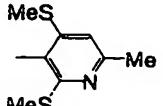
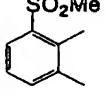
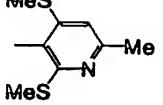
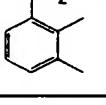
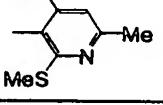
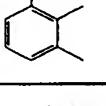
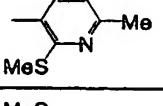
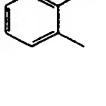
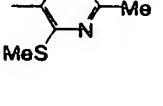
[表 6 8]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1287		O	S	単結合	1	
1288		O	S	単結合	2	
1289		O	S	単結合	3	
1290		O	S	単結合	4	
1291		O	S	単結合	5	
1292		O	S	単結合	6	
1293		O	S	単結合	7	
1294		O	S	単結合	8	
1295		O	S	単結合	9	
1296		O	S	単結合	14	

[表 6 9]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1297		O	S	単結合	1	
1298		O	S	単結合	2	
1299		O	S	単結合	3	
1300		O	S	単結合	4	
1301		O	S	単結合	5	
1302		O	S	単結合	6	
1303		O	S	単結合	7	
1304		O	S	単結合	8	
1305		O	S	単結合	9	
1306		O	S	単結合	14	

[表 70]

化合物番号		X	Y	Z	n	H e t
1307		O	S	単結合	1	
1308		O	S	単結合	2	
1309		O	S	単結合	3	
1310		O	S	単結合	4	
1311		O	S	単結合	5	

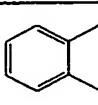
[表 7 1]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1317		O	S	単結合	1	
1318		O	S	単結合	2	
1319		O	S	単結合	3	
1320		O	S	単結合	4	
1321		O	S	単結合	5	
1322		O	S	単結合	6	
1323		O	S	単結合	7	
1324		O	S	単結合	8	
1325		O	S	単結合	9	
1326		O	S	単結合	14	

[表 7 2]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1327		O	S	単結合	1	
1328		O	S	単結合	2	
1329		O	S	単結合	3	
1330		O	S	単結合	4	
1331		O	S	単結合	5	
1332		O	S	単結合	6	
1333		O	S	単結合	7	
1334		O	S	単結合	8	
1335		O	S	単結合	9	
1336		O	S	単結合	14	

[表 7 3]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1337		O	S	単結合	1	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1338	同上	O	S	単結合	2	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1339	同上	O	S	単結合	3	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1340	同上	O	S	単結合	4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1341	同上	O	S	単結合	5	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1342	同上	O	S	単結合	6	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1343	同上	O	S	単結合	7	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1344	同上	O	S	単結合	8	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1345	同上	O	S	単結合	9	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1346	同上	O	S	単結合	14	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1347	同上	S	S	単結合	1	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1348	同上	S	S	単結合	2	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1349	同上	S	S	単結合	3	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1350	同上	S	S	単結合	4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1351	同上	S	S	単結合	5	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1352	同上	S	S	単結合	6	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1353	同上	S	S	単結合	7	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1354	同上	S	S	単結合	8	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1355	同上	S	S	単結合	9	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1356	同上	S	S	単結合	14	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル

[表 7-4]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1357		NH	S	単結合	1	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1358	同上	NH	S	単結合	2	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1359	同上	NH	S	単結合	3	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1360	同上	NH	S	単結合	4	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1361	同上	NH	S	単結合	5	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1362	同上	NH	S	単結合	6	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1363	同上	NH	S	単結合	7	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1364	同上	NH	S	単結合	8	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1365	同上	NH	S	単結合	9	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1366	同上	NH	S	単結合	14	4-メチル-6-メチルチオ-3-ピリジル
1367	同上	O	S	単結合	1	5-メチルチオ-2-ピリジル
1368	同上	O	S	単結合	2	5-メチルチオ-2-ピリジル
1369	同上	O	S	単結合	3	5-メチルチオ-2-ピリジル
1370	同上	O	S	単結合	4	5-メチルチオ-2-ピリジル
1371	同上	O	S	単結合	5	5-メチルチオ-2-ピリジル
1372	同上	O	S	単結合	6	5-メチルチオ-2-ピリジル
1373	同上	O	S	単結合	7	5-メチルチオ-2-ピリジル
1374	同上	O	S	単結合	8	5-メチルチオ-2-ピリジル
1375	同上	O	S	単結合	9	5-メチルチオ-2-ピリジル
1376	同上	O	S	単結合	14	5-メチルチオ-2-ピリジル

[表 75]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1377		S	S	単結合	1	5-メチルチオ-2-ピリジル
1378	同上	S	S	単結合	2	5-メチルチオ-2-ピリジル
1379	同上	S	S	単結合	3	5-メチルチオ-2-ピリジル
1380	同上	S	S	単結合	4	5-メチルチオ-2-ピリジル
1381	同上	S	S	単結合	5	5-メチルチオ-2-ピリジル
1382	同上	S	S	単結合	6	5-メチルチオ-2-ピリジル
1383	同上	S	S	単結合	7	5-メチルチオ-2-ピリジル
1384	同上	S	S	単結合	8	5-メチルチオ-2-ピリジル
1385	同上	S	S	単結合	9	5-メチルチオ-2-ピリジル
1386	同上	S	S	単結合	14	5-メチルチオ-2-ピリジル
1387	同上	NH	S	単結合	1	5-メチルチオ-2-ピリジル
1388	同上	NH	S	単結合	2	5-メチルチオ-2-ピリジル
1389	同上	NH	S	単結合	3	5-メチルチオ-2-ピリジル
1390	同上	NH	S	単結合	4	5-メチルチオ-2-ピリジル
1391	同上	NH	S	単結合	5	5-メチルチオ-2-ピリジル
1392	同上	NH	S	単結合	6	5-メチルチオ-2-ピリジル
1393	同上	NH	S	単結合	7	5-メチルチオ-2-ピリジル
1394	同上	NH	S	単結合	8	5-メチルチオ-2-ピリジル
1395	同上	NH	S	単結合	9	5-メチルチオ-2-ピリジル
1396	同上	NH	S	単結合	14	5-メチルチオ-2-ピリジル

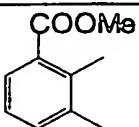
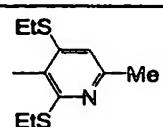
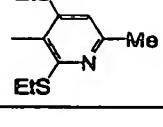
[表 7 6]

化合物番号	A	X	Y	Z	n	H e t
1397		O	S	単結合	1	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1398	同上	O	S	単結合	2	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1399	同上	O	S	単結合	3	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1400	同上	O	S	単結合	4	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1401	同上	O	S	単結合	5	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1402	同上	O	S	単結合	6	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1403	同上	O	S	単結合	7	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1404	同上	O	S	単結合	8	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1405	同上	O	S	単結合	9	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1406	同上	O	S	単結合	14	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1407	同上	S	S	単結合	1	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1408	同上	S	S	単結合	2	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1409	同上	S	S	単結合	3	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1410	同上	S	S	単結合	4	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1411	同上	S	S	単結合	5	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1412	同上	S	S	単結合	6	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1413	同上	S	S	単結合	7	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1414	同上	S	S	単結合	8	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1415	同上	S	S	単結合	9	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1416	同上	S	S	単結合	14	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル

[表 77]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1417		NH	S	単結合	1	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1418	同上	NH	S	単結合	2	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1419	同上	NH	S	単結合	3	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1420	同上	NH	S	単結合	4	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1421	同上	NH	S	単結合	5	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1422	同上	NH	S	単結合	6	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1423	同上	NH	S	単結合	7	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1424	同上	NH	S	単結合	8	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1425	同上	NH	S	単結合	9	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル
1426	同上	NH	S	単結合	14	2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル

[表 7 8]

化合物番号	(A)	X	Y	Z	n	H e t
1427		O	S	単結合	1	
1428		O	S	単結合	1	

本発明の一般式（I）で示される化合物は、A C A T 阻害作用及び／又は細胞内コレステロール輸送阻害作用を有し、高脂血症治療剤又は動脈硬化治療剤などとして医療分野で有用である。特に、本発明の化合物は血管壁に存在するタイプのA C A T 酵素を選択的に阻害する作用を示すことから、非選択的なA C A T 阻害剤に比べて副作用が少ないことが期待され、医薬の有効成分として好ましい。

本発明の医薬組成物は、一般式（I）で示される化合物、その酸付加塩又は溶媒和物を有効成分とするものであり、この有効成分の少なくとも1種を治療上有効な量と、製薬上許容される担体とからなるものである。

本発明の医薬組成物は、一般式（I）で示される化合物、その酸付加塩又は溶媒和物を有効成分とするものであり、この有効成分の少なくとも1種を単独で、又は、他の薬学的に許容される賦形剤、結合剤、担体、希釈剤などを当業者にはよく知られている担体を用いて、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、粉末剤、注射剤、坐剤等の、投与可能な剤型とすることができます。これらの製剤は公知の方法で製造することができる。例えば、経口投与用製剤とする場合には、一般式（I）で示される化合物を、澱粉、マンニトール、乳糖等の賦形剤：カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース等の結合剤：結晶セルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム等の崩壊剤：タルク、ステリン酸マグネシウム等の滑沢剤：軽質無水ケイ酸等の流動性向上剤などを適宜組み合わせて処方することにより製造することができる。

本発明の医薬組成物は、経口投与又は非経口投与により投与することができる。

本発明の医薬組成物の投与量は、患者の体重、年齢、性別、症状等によって異なるが、一般式（I）で示される化合物として、通常成人の場合、1日1～1000mg、好ましくは5～200mgを、1日1～3回に分けて投与するのが好ましい。

本発明の一般式（I）で示される化合物のA C A T 阻害作用を次に示す実験例で試験した。

実験例 1 (A C A T 阻害作用)

1 %コレステロール食で8週間飼育したウサギの胸部大動脈から常法によってミクロソームを調製し、0.15Mリン酸緩衝液(pH 7.4)に懸濁して酵素溶液とした。小腸由来の酵素溶液は、正常食のウサギ小腸から調製した。

ACAT阻害活性の測定は、J.G.ハイダー(J. Lipid Res., 24, 1127-1134, 1983)の方法を改変して行った。すなわち、 $^{14}\text{C}-\text{Oleoyl-CoA}$ (40 μM , 60000 dpm)、及び、ウシ血清アルブミン(2.4 mg/ml)を含む0.15Mリン酸緩衝液(pH 7.4)88 μl に、ジメチルスルホキシド(DMSO)に溶解した試験化合物2 μl を添加し、37°Cで5分間インキュベートした。

この液に、酵素溶液10 μl を加えて37°Cで5分間(小腸の場合は3分間。)反応した後、クロロホルム/メタノール(2/1)3 ml、及び、0.04N塩酸0.5 mlを加えて反応を停止し、脂質を抽出した。溶媒層を濃縮乾固した後、ヘキサンに溶解してTLCプレート(メルク社製)にスポットした。ヘキサン:エーテル:酢酸(75:25:1)で展開した。

生成したコレステロールエステル画分の放射活性をBAS2000(富士フィルム社製)で測定し、DMSOのみを添加したコントロールとの対比計算よりIC₅₀値を求めた。結果を表79に示した。

【表 7 9】

試験化合物 (化合物番号)	血管壁由来の酵素 IC ₅₀ (μM)	小腸由来の酵素 IC ₅₀ (μM)	IC ₅₀ (小腸) / IC ₅₀ (血管壁)
795	0.028	0.016	0.6
811	0.014	0.38	27.1
815	0.014	0.017	1.2
818	0.0056	0.016	2.9
831	0.63	0.61	1.0
対照(1)	0.45	0.87	1.9
対照(2)	0.047	0.13	2.8
対照(3)	0.034	0.056	1.7
対照(4)	0.026	0.037	1.4
対照(5)	0.01	0.065	6.5
対照(6)	0.11	0.51	4.6

実験例 2 (J 7 4.4 細胞およびH e p G 2 細胞におけるA C A T 阻害作用（抗泡沫化作用）)

J 7 7 4 細胞またはH e p G 2 細胞を 2 4 穴プレートに播種し、 J 7 7 4 細胞はD M E M、 H e p G 2 細胞はM E M 培養液（それぞれ 1 0 % 牛胎児血清を含む）を用い、 3 7 ℃で、 5 % C O₂ インキュベーターにて 2 4 時間培養した。

1 0 μ g / m l の 2 5 - O H コレステロール、及び、検体を含む各培養液 0 . 5 m l に交換後、さらに 1 8 時間培養した。

培地を除き P B S で 2 回洗浄後 1 . 5 m l のヘキサン：イソプロパノール（3 : 2 ）で抽出し、濃縮乾固した。抽出物を 0 . 2 m l の 1 0 % T r i t o n X - 1 0 0 を含むイソプロパノールに溶解し、総コレステロール（T C ）及び遊離コレステロール（F C ）を、それぞれコレステロール E テストワコー（和光純薬工業）、遊離コレステロール E テストワコー（和光純薬工業）で測定した。

細胞の抽出残さを 0 . 2 5 m l の 2 N N a O H に 3 7 ℃で、 3 0 分間で可溶化し、 B C A P r o t e i n A s s a y R e a g e n t (P i e r c e) で蛋白量を測定した。

T C と F C の差から蛋白あたりのコレステロールエステル量を算出し、コントロールとの対比計算から I C₅₀ 値を求めた。結果を表 8 0 に示した。

【表 80】

試験化合物 (化合物番号)	J774 細胞酵素 IC ₅₀ (μM)	HepG2 由来酵素 IC ₅₀ (μM)	IC ₅₀ (HepG2) / IC ₅₀ (J774)
795	0. 050	0. 35	7. 0
797	0. 0036	0. 029	8. 1
811	0. 050	1. 8	36. 0
815	0. 12	2. 6	21. 7
818	0. 062	0. 063	1. 0
831	0. 057	5. 4	94. 7
1253	0. 0041	0. 0044	1. 1
1282	0. 0032	0. 0062	1. 9
1292	0. 0027	0. 030	11. 1
1294	0. 0042	0. 0024	0. 6
1302	0. 0021	0. 015	7. 1
対照 (1)	0. 56	5. 3	9. 5
対照 (2)	0. 58	1. 1	1. 9
対照 (3)	0. 32	1. 3	4. 3
対照 (4)	0. 12	0. 75	6. 3
対照 (5)	1. 9	1. 6	0. 8
対照 (6)	0. 28	9. 1	32. 8

対照化合物として、下記の対照化合物（1）～（6）を同様な方法で試験した結果も表64、及び、表65に併せて示されている。対照化合物として用いた対照化合物（1）～（6）は、次のものである。

対照化合物（1）：5-[2-[2-(2-(4-フルオロフェニル)エチル)-3-(1-メチル-1H-イミダゾール-2-イル)-2H-1-ベンゾピラン-6-イル]オキシ-2,2-ジメチル-N-(2,6-ジイソブロピルフェニル)ベンタシアミド（WO 92/09582）

対照化合物（2）：(+)-(S)-2-[5-(3,5-ジメチルビラゾール-1-イル)ペンタスルフィニル]-4,5-ジフェニルイミダゾル（EP 523941）

対照化合物（3）：N-(2,2,5,5-テトラメチル-1,3-ジオキサン-4-イルカルボニル)-β-アラニン-2(S)-[N'-(2,2-ジメチルプロピル)-N'-ノニルウレイド]-1(S)-シクロヘキシリエステル（EP 421441）

対照化合物（4）：[5-(4,5-ジフェニル-1H-イミダゾール-2-イルチオ)ペンチル]-N-ヘプチル-2-ベンゾオキサゾールアミン（WO 93/23392）

対照化合物（5）：6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(2,6-ジイソブロピルフェニル)ヘキサンアミド
(特願平9-88660号の化合物)

対照化合物（6）：2-[4-[2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)エチル]ピペラジン-1-イル]-N-(2,6-ジイソブロピルフェニル)アセトアミド
(特願平9-149892号の化合物)

実施例

以下に、実施例により本発明を具体的に説明するが、本発明はこれらの実施例に限定されるものではない。

実施例 1 (表中の化合物番号 5 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミドの製造:

ナトリウムチオメトキシド (2.10 g, 28.5 mmol) のメタノール (30 ml) 溶液に、氷冷下で 2-クロロ-3-ニトロピリジン (4.30 g, 27.1 mmol) のメタノール (50 ml) 溶液を滴下し、17時間攪拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後溶媒を留去し、得られた結晶を酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、2-メチルチオ-3-ニトロピリジン 2.93 g (収率 64 %) を黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (851 mg, 5.0 mmol) を酢酸 (35 ml) と濃塩酸 (1.4 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (3.92 g, 60 mmol) を少量ずつ加えた。30分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-2-メチルチオピリジン 600 mg (収率 86 %) を淡黄色油状物として得た。

このアミノピリジン (600 mg, 4.28 mmol) の THF (7 ml) 溶液にトリエチルアミン (520 mg, 5.14 mmol) を加え、次いで氷冷下で 6-ブロモヘキサン酸クロリド (1.10 g, 5.14 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を、シリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 125 g; 展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 6 : 1 → 3 : 1 → 2 : 1) で精製して、6-ブロモ-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミド 1.08 g (収率 79 %) を無色針状晶 (融点: 66 - 67 °C) として得た。

このアミド (159 mg, 0.5 mmol) と 2-メルカブトベンゾオキサゾール (83 mg, 0.55 mmol) の DMF (2 ml) 溶液に、18-クラウン-6 (13 mg, 0.05 mmol) と炭酸カリウム (83 mg, 0.6 mmol) を加え、80°Cで、3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗

浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を、シリカゲルクロマトグラフィー（シリカゲル20 g、展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 5 : 2 → 2 : 1）で精製して目的化合物 156 mg（収率 81 %）を無色針状晶として得た。

融点 : 127 - 128 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3447, 3265, 1654,
1522, 1508..

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.58 - 1.65 (2H, m), 1.83 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
1.92 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.46 (2H, t, J = 7.4 Hz),
2.62 (3H, s), 3.34 (2H, t, J = 7.4 Hz),
7.06 (1H, dd, J = 8.1, 4.6 Hz), 7.21 - 7.30 (3H, m),
7.44 (1H, m), 7.59 (1H, m), 8.26 (1H, d, J = 4.6 Hz),
8.28 (1H, d, J = 8.1 Hz).

E I M S m/z (relative intensity) : 387 (M⁺), 165 (100).

元素分析 : C₁₉H₂₁N₃O₂S₂として

計算値 : C, 58.89; H, 5.46; N, 10.84; S, 16.55.

実測値 : C, 58.92; H, 5.43; N, 10.78; S, 16.55.

実施例 2 (表中の化合物番号 8 の化合物)

9-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造：

6-ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに、9-ブロモノナン酸クロリドを用いて、実施例 1 と同様に反応・処理し、9-ブロモ-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドを得た。

このアミド (90 mg, 0.25 mmol) と 2-メルカブトベンゾオキサゾール (38 mg, 0.25 mmol) のDMF (5 ml) 溶液に、炭酸カリウム (42 mg, 0.30 mmol)、18-クラウン-6 (7 mg, 0.03 mmol) を加え、80 °Cで、3時間攪拌した。反応混合物を放冷後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た残渣を、酢酸エチル - ヘキサンより

再結晶し、目的化合物 83 mg (収率 77 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 84 - 85 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3465, 3276, 2926,
1664, 1505

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.35 - 1.53 (8H, m), 1.72 - 1.77 (2H, m),
1.80 - 1.87 (2H, m), 2.42 (2H, t, J = 7.3 Hz),
2.63 (3H, s), 3.31 (2H, t, J = 7.4 Hz),
7.06 (1H, dd, J = 8.0, 4.7 Hz), 7.21 - 7.30 (3H, m),
7.43 (1H, dd, J = 7.0, 0.6 Hz), 7.59 (1H, dd, J = 7.6, 0.6 Hz),
8.25 (1H, d, J = 4.7 Hz), 8.31 (1H, d, J = 7.8 Hz).

E I M S m/z (relative intensity) : 429 (M⁺), 297 (100).

元素分析 : C₂₂H₂₂N₃O₂S₂として

計算値 : C, 61.51; H, 6.33; N, 9.78; S, 14.93.

実測値 : C, 61.51; H, 6.28; N, 9.64; S, 14.99.

実施例 3 (表中の化合物番号 15 の化合物)

6-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 1 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 118 - 119°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3429, 3265, 1654,
1522, 1508.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.83 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
1.91 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.46 (2H, t, J = 7.4 Hz),
2.61 (3H, s), 3.38 (2H, t, J = 7.4 Hz),
7.06 (1H, dd, J = 8.1, 4.9 Hz), 7.25 (1H, br s), 7.29 (1H, m),

7.41 (1H, m), 7.75 (1H, m), 7.86 (1H, m),
8.25 (1H, d, J = 4.9 Hz), 8.29 (1H, d, J = 8.1 Hz).

E I M S m/z (relative intensity) : 403 (M⁺), 223 (100).

元素分析 : C₁₉H₂₁N₃O₂S₃として

計算値 : C, 56.55; H, 5.24; N, 10.41; S, 23.83.

実測値 : C, 56.69; H, 5.30; N, 10.24; S, 23.77.

実施例4 (表中の化合物番号18の化合物)

9-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-(2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例2と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 107-108°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3448, 3256, 2923,
1656, 1525.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.24 - 1.34 (6H, m), 1.36 - 1.43 (2H, m),
1.54 - 1.59 (2H, m), 1.69 - 1.77 (2H, m),
2.26 (2H, t, J = 7.4 Hz), 2.40 (3H, s), 3.28 (2H, t, J = 7.2 Hz),
7.01 (1H, dd, J = 7.8, 4.6 Hz), 7.26 (1H, dt, J = 8.1, 1.2 Hz),
7.36 (1H, dt, J = 7.3, 1.2 Hz), 7.58 (1H, dd, J = 7.8, 1.5 Hz),
7.74 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.85 (1H, dd, J = 7.3, 1.2 Hz),
8.21 (1H, dd, J = 4.6, 1.5 Hz), 8.73 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 445 (M⁺), 297 (100).

元素分析 : C₂₂H₂₇N₃O₂S₃として

計算値 : C, 59.29; H, 6.11; N, 9.43; S, 21.58.

実測値 : C, 59.12; H, 6.02; N, 9.25; S, 21.62.

実施例5 (表中の化合物番号25の化合物)

6 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - (2-メチルチオ-3-ピリジル) ヘキサンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例1と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色針状晶として得た。

融点：121-123°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3386, 3276, 1658,
1511, 1398.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.52-1.60 (2H, m), 1.74-1.86 (4H, m),
2.42 (2H, t, J = 7.2 Hz), 2.60 (3H, s),
3.32 (2H, t, J = 7.2 Hz), 7.05 (1H, dd, J = 8.1, 4.9 Hz),
7.18-7.19 (2H, m), 7.32 (1H, br s),
7.36 (1H, br s), 7.66 (1H, br s),
8.23-8.26 (2H, m), 9.84 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity) : 386 (M⁺), 205 (100).

元素分析 : C₁₉H₂₂N₄OS₂として

計算値 : C, 59.04; H, 5.74; N, 14.49; S, 16.59.

実測値 : C, 59.06; H, 5.76; N, 14.35; S, 16.57.

実施例6 (表中の化合物番号28の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - (2-メチルチオ-3-ピリジル) ノナンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例2と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

IR (KBr) cm⁻¹ : 3260, 2929, 2851,
1664, 1519, 1394.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.31 - 1.47 (6H, m), 1.57 - 1.61 (2H, m),
 1.69 - 1.79 (4H, m), 2.42 (2H, t, J = 7.2 Hz), 2.63 (3H, s),
 3.32 (2H, t, J = 7.4 Hz), 7.06 (1H, dd, J = 8.1, 4.6 Hz),
 7.18 - 7.23 (4H, m), 7.67 (1H, br s),
 8.26 (1H, d, J = 4.6 Hz), 8.30 (1H, d, J = 7.8 Hz),
 9.31 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 428 (M⁺), 164 (100).

実施例 7 (表中の化合物番号 158 の化合物)

9-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造:

2-クロロ-3-ニトロピリジンの代わりに2-クロロ-4-メチル-3-ニトロピリジンを用いて実施例1と同様に反応・処理し、4-メチル-2-メチルチオ-3-ニトロピリジンを得た。このニトロピリジン (474 mg, 2.57 mmol) を酢酸 (18 ml) と濃塩酸 (0.7 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (2.02 g, 30.88 mmol) を少量ずつ加えた。30分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジン 307 mg (収率 77%) を無色結晶として得た。

このアミノピリジン (307 mg, 1.99 mmol) のクロロホルム (4 ml) 溶液にトリエチルアミン (302 mg, 2.99 mmol) を加え、次いで氷冷下で9-ブロモノナン酸クロリド (2.99 mmol) のクロロホルム (4 ml) 溶液をゆっくりと滴下し、室温で3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 125 g, 展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 3:1 → 2:1) で精製して9-ブロモ-N-(4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミド 261 mg (収率 35%) を無色粉末晶 (融点: 77 - 78°C) として得た。このアミド (114 mg, 0.31 mmol) と2-メルカプ

トベンゾオキサゾール (46 mg, 0.31 mmol) の D M F (5 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (8 mg, 0.03 mmol) と炭酸カリウム (51 mg, 0.37 mmol) を加え、80°C で 2 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒: クロロホルム: メタノール = 20: 1) で精製して目的化合物 89 mg (収率 66 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 91 - 92 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3433, 3268, 2924,
1518, 1496.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.36 - 1.53 (8H, m), 1.74 - 1.88 (4H, m), 2.21 (3H, s),
2.43 (2H, t, J = 7.6 Hz), 2.53 (3H, s), 3.32 (2H, t, J = 7.3 Hz)
6.63 (1H, br s), 6.90 (1H, d, J = 5.1 Hz),
7.22 - 7.30 (1H, m), 7.43 (1H, dd, J = 7.2, 1.4 Hz),
7.60 (1H, dd, J = 7.6, 1.4 Hz), 8.24 (1H, d, J = 4.9 Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 443 (M⁺, 100).

元素分析 : C₂₃H₂₉N₃O₂S₂として

計算値 : C, 62.27; H, 6.59; N, 9.47; S, 14.45.

実測値 : C, 62.34; H, 6.58; N, 9.33; S, 14.44.

実施例 8 (表中の化合物番号 168 の化合物)

9-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-(4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 88 - 90 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3449, 3271, 2925,
1657, 1425, 997.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.37 - 1.53 (8H, m), 1.73 - 1.87 (4H, m), 2.21 (3H, s),
 2.43 (2H, t, J = 7.6 Hz), 2.53 (3H, s), 3.35 (2H, t, J = 7.3 Hz),
 6.62 (1H, br s), 6.90 (1H, d, J = 5.1 Hz),
 7.23 - 7.31 (1H, m), 7.39 - 7.43 (1H, m),
 7.75 (1H, dd, J = 8.1, 0.5 Hz), 7.86 (1H, dd, J = 8.1, 0.5 Hz),
 8.24 (1H, d, J = 5.1 Hz).

元素分析 : C₂₃H₂₉N₃O₂S₃として

計算値 : C, 60.10; H, 6.36; N, 9.14.

実測値 : C, 59.99; H, 6.36; N, 9.00.

実施例9 (表中の化合物番号275の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,6-ビス(メチルチオ)-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造 :

2-クロロ-3-ニトロピリジンの代わりに2,6-ジクロロ-3-ニトロピリジンを用いて実施例1と同様に反応・処理し、2,6-ビス(メチルチオ)-3-ニトロピリジンを得た。このニトロピリジン(800 mg, 3.70 mmol)を酢酸(100 ml)と濃塩酸(5.6 ml)の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛(2.90 g, 44.39 mmol)を少量ずつ加えた。30分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1)で精製して、3-アミノ-2,6-ビス(メチルチオ)ピリジン 301 mg(収率 44%)を淡黄色粉末晶として得た。

このアミノピリジン(301 mg, 1.62 mmol)のTHF(3 ml)溶液にトリエチルアミン(196 mg, 1.94 mmol)を加え、次いで氷冷下で6-ブロモヘキサン酸クロリド(345 mg, 1.62 mmol)のTHF(1 ml)溶液をゆっくりと滴下し、0°Cで3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1)で

精製して 6 - ブロモ - N - [2, 6 - ビス (メチルチオ) - 3 - ピリジル] ヘキサンアミド 453 mg (收率 77 %) を無色粉末晶 (融点 : 117 - 119°C) として得た。このアミド (100 mg, 0.28 mmol) と 2 - メルカブトベンゾオキサゾール (42 mg, 0.28 mmol) の DMF (4 ml) 溶液に 18 - クラウン - 6 (7 mg, 0.03 mmol) と 炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol) を加え、80°Cで3時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を酢酸エチル - ヘキサンより再結晶し、目的化合物 83 mg (收率 70 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 125 - 126°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3436, 3253, 2937,
1653, 1519, 1505.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.78 - 1.86 (2H, m), 1.88 - 1.95 (2H, m),
2.44 (2H, t, J = 7.4 Hz), 2.57 (3H, s), 2.62 (3H, s),
3.33 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.93 (1H, d, J = 8.4 Hz),
7.02 (1H, br s), 7.21 - 7.30 (2H, m),
7.43 (1H, dd, J = 7.4, 1.7 Hz),
7.59 (1H, dd, J = 7.4, 1.7 Hz), 8.01 (1H, d, J = 8.4 Hz).

元素分析 : C₂₀H₂₃N₃O₂S₃として

計算値 : C, 55.40; H, 5.35; N, 9.69.

実測値 : C, 55.53; H, 5.38; N, 9.68.

実施例 10 (表中の化合物番号 455 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (6 - メチル - 2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ヘキサンアミドの製造 :

2 - クロロ - 3 - ニトロピリジンの代わりに 2 - クロロ - 6 - メチル - 3 - ニトロピリジンを用いて実施例 1 と同様に反応・処理し、6 - メチル - 2 - メチルチオ - 3 - ニトロピリジンを得た。このニトロピリジン (921 mg, 5.0 mmol) を酢酸 (40 ml) と濃塩酸 (1.75 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (3.81 g,

60 mmol) を少量ずつ加えた。30分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-6-メチル-2-メチルチオピリジン 685 mg (収率 88 %) を黄色油状物として得た。

このアミノピリジン (601 mg, 3.9 mmol) のクロロホルム (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (475 mg, 4.7 mmol) を加え、次いで氷冷下で 6-ブロモヘキサン酸クロリド (944 mg, 4.29 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で 12時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後塩化メチレンで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 50 g, 展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 10 : 1 → 5 : 1) で精製して 6-ブロモ-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル) ヘキサンアミド 773 mg (収率 59 %) を無色結晶 (融点: 98 - 99°C) として得た。このアミド (133 mg, 0.4 mmol) と 2-メルカブトベンゾオキサゾール (67 mg, 0.44 mmol) の DMF (2 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (11 mg, 0.04 mmol) と炭酸カリウム (67 mg, 0.44 mmol) を加え、80°Cで 90 分間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 20 g, 展開溶媒: ヘキサン: アセトン = 5 : 1 → 5 : 3) で精製して目的化合物 125 mg (収率 78 %) を無色針状晶として得た。

融点: 140 - 141°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3437, 3267, 1654,
1528, 1506.

¹H-NMR (CDCl₃) δ:

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.82 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
1.91 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.44 (2H, t, J = 7.4 Hz),
2.48 (3H, s), 2.60 (3H, s), 3.33 (2H, t, J = 7.4 Hz),
6.90 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.21 - 7.30 (2H, m), 7.43 (1H, m),
7.59 (1H, m), 8.13 (1H, d, J = 8.1 Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 401 (M⁺), 203 (100).

元素分析 : C₂₀H₂₃N₃O₂S₂として

計算値 : C, 59.82; H, 5.77; N, 10.46.

実測値 : C, 59.90; H, 5.84; N, 10.32.

実施例 1 1 (表中の化合物番号 458 の化合物)

9-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造:

3-アミノ-6-メチル-2-メチルチオピリシン (685 mg, 4.44 mmol) のクロロホルム (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (607 mg, 6.0 mmol) を加え、次いで氷冷下で 9-ブロモノナン酸クロリド (1281 mg, 5 mmol) のクロロホルム (3 ml) 溶液をゆっくりと滴下し、室温で 17 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 75g, 展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 10:1 → 4:1) で精製して 9-ブロモ-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミド 433 mg (収率 27 %) を無色結晶 (融点: 80 - 82°C) として得た。

このアミド (131 mg, 0.35 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (58 mg, 0.385 mmol) の DMF (1.5 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (9 mg, 0.035 mmol) と 炭酸カリウム (58 mg, 0.42 mmol) を加え、80°Cで 3 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 30 g, 展開溶媒: ヘキサン: 酢酸エチル = 4:1 → 3:1) で精製して目的化合物 123 mg (収率 79 %) を無色針状晶として得た

融点 : 99 - 100°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3421, 3235, 2924,
1655, 1528, 1497,
1455.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.32-1.42 (6H, m), 1.43-1.51 (2H, m), 1.70-1.78 (2H, m),
 1.83 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.40 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 2.48 (3H, s), 2.61 (3H, s), 3.31 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 6.90 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.21-7.30 (3H, m), 7.43 (1H, m),
 7.60 (1H, m), 8.15 (1H, d, J = 8.1 Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 443 (M⁺), 311 (100).

実施例 1 2 (表中の化合物番号 4 6 5 の化合物)

6 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - (6 - メチル - 2 - メチルチオ - 3 - ピリジル) ヘキサンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 1 0 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 122-123°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3438, 3290, 1656,
 1515, 1431.

¹H - N M R (CDCl₃) δ :

1.57 - 1.65 (2H, m), 1.82 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
 1.90 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.44 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 2.48 (3H, s), 2.60 (3H, s), 3.37 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 6.90 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.22 (1H, br s) 7.29 (1H, m),
 7.41 (1H, m), 7.75 (1H, m), 7.86 (1H, m), 8.13 (1H, J = 8.3 Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 417 (M⁺), 168 (100).

元素分析 : C₂₀H₂₃N₃O₂S₃として

計算値 : C, 57.52; H, 5.55; N, 10.06.

実測値 : C, 57.65; H, 5.63; N, 9.97.

実施例 1 3 (表中の化合物番号 4 6 8 の化合物)

9 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - (6 - メチル - 2 - メチルチ

オ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 11 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 104-105°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3280, 2924, 1662,
1527, 1428.

¹H-NMR (CDC13) δ :

1.32-1.41 (6H, m), 1.43-1.51 (2H, m), 1.70-1.77 (2H, m),
1.82 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.40 (2H, t, J = 7.4 Hz),
2.48 (3H, s), 2.61 (3H, s), 3.34 (2H, t, J = 7.4 Hz),
6.90 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.22 (1H, br s) 7.29 (1H, m),
7.41 (1H, m), 7.76 (1H, m), 7.86 (1H, m),
8.15 (1H, d, J = 8.1 Hz),

EIMS m/z (relative intensity) : 459 (M⁺), 293 (100).

元素分析 : C₂₃H₂₉N₃O₂S₃として

計算値 : C, 60.10; H, 6.36; N, 9.14.

実測値 : C, 60.17; H, 6.40; N, 9.11.

実施例 14 (表中の化合物番号 475 の化合物)

6-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 10 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 138-140°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3385, 3244, 1668,
1509, 1440.

¹H-NMR (CDC13) δ :

1.53 - 1.61 (2H, m), 1.78 (2H, quint, J = 7.6 Hz),
 1.82 (2H, quint, J = 7.6 Hz), 2.41 (2H, t, J = 7.6 Hz),
 2.48 (3H, s), 2.59 (3H, s), 3.31 (2H, t, J = 7.6 Hz),
 6.88 (1H, d, J = 8.3 Hz), 7.16 - 7.23 (2H, m), 7.31-7.32 (2H, m),
 7.67 (1H, m), 8.08 (1H, d, J = 8.3 Hz), 9.72 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 400 (M⁺), 164 (100).

元素分析 : C₂₀H₂₄N₄O₂S₂として

計算値 : C, 59.97; H, 6.04; N, 13.99.

実測値 : C, 60.08; H, 6.08; N, 13.94.

実施例 15 (表中の化合物番号 478 の化合物)

9-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ノナンアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 11 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 73 - 75 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3254, 2926, 1663,
 1515, 1438.

¹H-NMR (CDC13) δ :

1.27-1.43 (8H, m), 1.68-1.78 (4H, m), 2.40 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 2.48 (3H, s), 2.60 (3H, s), 3.31 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 6.89 (1H, d, J = 8.1 Hz), 7.17-7.20 (2H, m), 7.31-7.33 (2H, m),
 7.67 (1H, m), 8.13 (1H, d, J = 8.1 Hz), 9.69 (1H, br s).

実施例 16 (表中の化合物番号 781 の化合物)

2-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造 :

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジン (492 mg, 2.

46 mmol) のクロロホルム (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (274 mg, 2.71 mmol) を加え、次いで氷冷下でプロモ酢酸プロミド (521 mg, 2.58 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で2時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、塩化メチレンで抽出し、有機層を1N塩酸、水、炭酸水素ナトリウム水溶液、水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル25 g, 展開溶媒: ヘキサン: アセトン = 7: 1 → 5: 1 → 3: 1) で精製して2-プロモ-N-[2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミド 100 mg (収率 13 %) を無色結晶 (融点: 171 - 172°C) として得た。

このアミド (96 mg, 0.3 mmol) と2-メルカブトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.3 mmol) のアセトニトリル (5 ml) 溶液に炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol) を加え、室温で90分間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル10 g, 展開溶媒: ヘキサン: アセトン = 5: 2) で精製して目的化合物 88 mg (収率 75 %) を無色結晶として得た。

融点 : 203 - 205°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3437, 3238, 1669,
1509, 1454.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

2.31 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.46 (3H, s), 4.10 (2H, s),
6.61 (1H, s), 7.28 - 7.33 (2H, m), 7.49 (1H, m), 7.60 (1H, m),
8.77 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 391 (M⁺), 227 (100).

元素分析 : C₁₇H₁₇N₃O₂S₃として

計算値 : C, 52.15; H, 4.38; N, 10.73.

実測値 : C, 52.14; H, 4.44; N, 10.57.

実施例 17 (表中の化合物番号 783 の化合物)

4 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] プタンアミドの製造：

3 - アミノ - 2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチルピリジン (341 mg, 1.70 mmol) の THF (6 ml) 溶液にトリエチルアミン (206 mg, 2.04 mmol) を加え、次いで氷冷下で 4 - ブロモブタン酸クロリド (379 mg, 2.04 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (シリカゲル 75 g, 展開溶媒；ヘキサン : アセトン = 5 : 1 → 3 : 1) で精製して 4 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] プタンアミド 390 mg (収率 66 %) を無色結晶 (融点 : 139 - 140°C) として得た。

このアミド (105 mg, 0.3 mmol) と 2 - メルカプトベンゾオキサゾール (50 mg, 0.33 mmol) の DMF (2 ml) 溶液に 18 - クラウン - 6 (8 mg, 0.03 mmol) と炭酸カリウム (50 mg, 0.36 mmol) を加え、80°Cで 3 時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒；ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 2, 2 回展開) で精製して目的化合物 67 mg (収率 53 %) を無色針状晶として得た。

融点 : 149 - 150°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3437, 3248, 1667,
1503, 1455.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

2.13 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s),
2.44 (3H, s), 2.49 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.43 (2H, t, J = 7.2 Hz),
6.88 (1H, s), 7.30 - 7.37 (2H, m), 7.64 - 7.68 (2H, m),
9.45 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity) : 419 (M⁺, 100).

元素分析 : C₁₉H₂₁N₃O₂S₃として

計算値 : C, 54.39; H, 5.04; N, 10.01.

実測値 : C, 54.58; H, 5.08; N, 9.98.

実施例 18 (表中の化合物番号 785 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに6-ブロモヘキサン酸クロリドを用いて実施例 17 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 120-121°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3433, 3235, 1662,
1502, 1455.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.44 - 1.54 (2H, m), 1.58 - 1.68 (2H, m), 1.72 - 1.82 (2H, m),
2.18 - 2.27 (2H, m), 2.32 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.37 (3H, s),
3.27 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.78 (1H, s), 7.19 - 7.26 (2H, m),
7.47 - 7.53 (2H, m), 8.74 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 446 (M⁺-1), 200 (100).

元素分析 : C₂₁H₂₅N₃O₂S₃として

計算値 : C, 56.35; H, 5.63; N, 9.39; S, 21.49.

実測値 : C, 56.42; H, 5.62; N, 9.26; S, 21.39.

実施例 19 (表中の化合物番号 788 の化合物)

9-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造:

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに9-ブロモノナン酸クロリドを用いて実施例 17 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 123-124°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3461, 3246, 1671,
1504, 1454.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.26 - 1.46 (8H, m), 1.53 - 1.63 (2H, m), 1.72 - 1.83 (2H, m),
 2.24 (2H, t, J = 7.3 Hz), 2.37 (3H, s), 2.37 (3H, s),
 2.43 (3H, s), 3.31 - 3.41 (2H, m), 6.86 (1H, s),
 7.27 - 7.34 (2H, m), 7.58 - 7.66 (2H, m), 9.26 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 489 (M⁺, 100).

元素分析 : C₂₄H₃₁N₃O₂S₃として

計算値 : C, 58.86; H, 6.38; N, 8.58; S, 19.64.

実測値 : C, 58.94; H, 6.37; N, 8.44; S, 19.55.

実施例 20 (表中の化合物番号 793 の化合物)

4-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例17と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 131 - 133°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3435, 3250, 1665,
 1509, 1428.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

2.11 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s),
 2.44 (3H, s), 2.49 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.46 (2H, t, J = 7.2 Hz),
 6.88 (1H, s), 7.37 (1H, m), 7.47 (1H, m), 7.87 (1H, m),
 8.02 (1H, m), 9.45 (1H, s).

E I M S m/z (relative intensity): 435 (M⁺), 168 (100).

元素分析 : C₁₉H₂₁N₃O₂S₄として

計算値 : C, 52.39; H, 4.86; N, 9.65.

実測値 : C, 52.39; H, 4.84; N, 9.56.

実施例 21 (表中の化合物番号 795 の化合物)

6-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチ

オ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンアミドの製造：

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 18 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色結晶として得た。

融点 : 123 - 125 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3433, 3258, 2923,
1661, 1429

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.49 - 1.58 (6H, m), 1.67 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
1.83 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.29 (2H, t, J = 7.2 Hz),
2.38 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.45 (3H, s),
3.38 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.68 (1H, s),
7.36 (1H, td, J = 8.0, 1.0 Hz), 7.46 (1H, td, J = 8.0, 1.0 Hz),
7.86 (1H, dd, J = 8.0, 1.0 Hz), 8.01 (1H, br d, J = 8.0 Hz),
9.31 (1H, s).

EIMS m/z (relative intensity) : 463 (M⁺), 201 (100).

元素分析 : C₂₁H₂₅N₃O₂S₄として

計算値 : C, 54.40; H, 5.43; N, 9.06; S, 27.66.

実測値 : C, 54.42; H, 5.45; N, 8.79; S, 27.68.

実施例 22 (表中の化合物番号 798 の化合物)

9 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造：

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 19 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 126 - 127 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3440, 3252, 2924,
1661, 1430.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.31 - 1.52 (8H, m), 1.59 - 1.68 (2H, m), 1.77 - 1.85 (2H, m),
 2.23 - 2.33 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
 3.36 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.86 (1H, s),
 7.34 (1H, dt, J = 7.8, 1.2 Hz),
 7.44 (1H, dt, J = 7.8, 1.2 Hz), 7.83 (1H, d, J = 8.3 Hz),
 7.93 (1H, dt, J = 7.8, 0.6 Hz), 8.78 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 504 (M⁺-1), 200 (100).

元素分析 : C₂₄H₃₁N₃O₂S₄として

計算値 : C, 57.00; H, 6.18; N, 8.31; S, 25.36.

実測値 : C, 57.08; H, 6.17; N, 8.15; S, 25.41.

実施例 2 3 (表中の化合物番号 803 の化合物)

4-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 1 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色針状晶として得た。

融点 : 177 - 179°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3421, 3147, 1659,
 1645, 1438.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

2.06 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.38 (3H, s), 2.39 (3H, s),
 2.44 (3H, s), 2.46 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.36 (2H, t, J = 7.2 Hz),
 6.88 (1H, s), 7.09 - 7.13 (2H, m), 7.34 - 7.52 (2H, m),
 9.48 (1H, s), 12.54 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 418 (M⁺), 150 (100).

実施例 2 4 (表中の化合物番号 805 の化合物)

6 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] ヘキサンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例18と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点： 139-141°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3433, 3244, 2924,
1659, 1437.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.47-1.56 (2H, m), 1.65 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
1.76 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.28 (2H, t, J = 7.2 Hz),
2.38 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.44 (3H, s),
3.29 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.68 (1H, s),
7.08-7.13 (2H, m), 7.36 (1H, m), 7.50 (1H, m), 9.30 (1H, s),
12.50 (1H, br s)

EIMS m/z (relative intensity): 446 (M⁺), 200 (100).

実施例25 (表中の化合物番号808の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] ノナンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例19と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

IR (KBr) cm⁻¹ : 3146, 2925, 2854,
1660, 1523, 1437.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25-1.44 (8H, m), 1.53-1.61 (2H, m), 1.65-1.74 (2H, m),
2.24 (2H, t, J = 7.3 Hz), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s),
2.43 (3H, s), 3.26 (2H, t, J = 7.1 Hz), 6.86 (1H, s),

7.07 - 7.12 (2H, m), 7.32 - 7.37 (1H, m), 7.46 - 7.54 (1H, m),
9.26 (1H, s).

E I M S m/z (relative intensity): 488 (M⁺), 150 (100).

実施例 2 6 (表中の化合物番号 8 1 1 の化合物)

2-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

ナトリウムエトキシド (1.27 g, 25 mmol) のエタノール (50 ml) 溶液に、氷冷下でエタンチオール (1.55 g, 25 mmol) を滴下し 30 分間攪拌した。氷冷下のまま、2,4-ジクロロ-6-メチル-3-ニトロピリジン (2.1 g, 10 mmol) の D M F (40 ml) 溶液をゆっくりと滴下した。2 時間攪拌後、反応混合物を酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ニトロピリジン 2.45 g (収率 95 %) を黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (775 mg, 3 mmol) を酢酸 (30 ml) と濃塩酸 (1.5 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (4 g, 60 mmol) を少量ずつ加えた。10 分間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を水酸化ナトリウム水溶液で中和し、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、3-アミノ-2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチルピリジン 590 mg (収率 86 %) を黄色油状物として得た。このアミノピリジン (590 mg, 2.6 mmol) の T H F (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (304 mg, 3 mmol) を加え、次いで氷冷下でプロモ酢酸プロミド (606 mg, 3 mmol) をゆっくりと滴下し、室温で 1 時間攪拌した。反応混合物を濾過し濾液を濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (シリカゲル 60 g、展開溶媒: ヘキサン: アセトン = 10:1 → 5:1) で精製して 2-プロモ-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミド 410 mg (収率 45 %) を薄褐色針状晶で得た。このアミド (105 mg, 0.3 mmol) と 2-メルカブトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.3 mmol) のアセトニトリル (3 ml) 溶液に炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol) を加え、室温で 2 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで抽

出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー（展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 1）で精製して目的化合物 70 mg（収率 56%）を無色針状晶として得た。

融点 : 143 - 145 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3429, 3224, 1673,
1509, 1454.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.17 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.5 Hz), 2.43 (3H, s),
2.81 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.04 (2H, q, J = 7.5 Hz), 4.11 (2H, s),
6.63 (1H, s), 7.25 - 7.33 (2H, m), 7.48 (1H, m), 7.61 (1H, m),
8.63 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 419 (M⁺), 268 (100).

元素分析 : C₁₉H₂₁N₃O₂S₃として

計算値 : C, 54.39; H, 5.04; N, 10.01.

実測値 : C, 54.39; H, 5.05; N, 10.00.

実施例 27 (表中の化合物番号 815 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造：

プロモ酢酸プロミドの代わりに6-プロモヘキサン酸クロリドを用いて実施例26と同様に反応・処理し、6-プロモ-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドを得た。このアミド (122 mg, 0.3 mmol) と2-メルカブトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.3 mmol) のDMF (2 mL) 溶液に炭酸カリウム (46 mg, 0.33 mmol)、18-クラウン-6 (8 mg, 0.03 mmol) を加え、80 °Cで1.5時間攪拌した。反応混合物を放冷後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た残渣を分取薄層クロマトグラフィー（展開溶媒；ヘキサン：アセトン = 5 : 2）で精製し目的化合物 65 mg（収率 46%）を薄褐色針状晶として得た。

融点 : 100 - 103°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3233, 2928, 1668,
1504, 1455.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.58 (2H, m),
1.70 (2H, m), 1.85 (2H, m), 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),
2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.07 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.35 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.89 (1H, s), 7.26 - 7.34 (2H, m),
7.54 - 7.62 (2H, m), 8.77 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 475 (M⁺, 100).

元素分析 : C₂₃H₂₉N₃O₂S₃として

計算値 : C, 58.08; H, 6.14; N, 8.83; S, 20.22.

実測値 : C, 58.07; H, 6.13; N, 8.66; S, 20.27.

実施例 28 (表中の化合物番号 818 の化合物)

9-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造 :

6-ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに9-ブロモノナン酸クロリドを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 84 - 87°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3252, 2923, 1665,
1501, 1455.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz),
1.28 - 1.52 (8H, m), 1.63 (2H, m), 1.82 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
2.26 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.07 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.34 (2H, t, J = 7.2 Hz),
6.88 (1H, s), 7.26 - 7.34 (2H, m),
7.54 - 7.62 (2H, m), 8.72 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 517 (M⁺), 367 (100).

元素分析 : C₂₆H₃₅N₃O₂S₃として

計算値 : C, 60.31; H, 6.81; N, 8.12.

実測値 : C, 60.52; H, 6.85; N, 7.85.

実施例 29 (表中の化合物番号 821 の化合物)

2-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 26 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 119 - 120 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3453, 3254, 1672,
1510, 1428.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.20 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.22 (3H, t, J = 7.4 Hz), 2.42 (3H, s),
2.82 (2H, q, J = 7.4 Hz), 3.06 (2H, q, J = 7.4 Hz), 4.18 (2H, s),
6.63 (1H, s), 7.33 (1H, m), 7.42 (1H, m), 7.77 (1H, m),
7.91 (1H, m), 8.95 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 435 (M⁺), 148 (100).

元素分析 : C₁₉H₂₁N₃O₂S₄として

計算値 : C, 52.39; H, 4.86; N, 9.65.

実測値 : C, 52.40; H, 4.86; N, 9.53.

実施例 30 (表中の化合物番号 825 の化合物)

6-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得

た。

融点 : 81 - 83 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3150, 2927, 1647,
1524, 1428.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.57 (2H, m),
1.69 (2H, m), 1.84 (2H, m), 2.29 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.93 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.36 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.87 (1H, s), 7.33 (1H, m),
7.43 (1H, m), 7.82 (1H, m), 7.92 (1H, m), 8.77 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 491 (M⁺), 168 (100).

元素分析 : C₂₃H₂₉N₃O₅S₄として

計算値 : C, 56.18; H, 5.94; N, 8.55; S, 26.08.

実測値 : C, 56.19; H, 5.91; N, 8.43; S, 26.06.

実施例 3 1 (表中の化合物番号 828 の化合物)

9-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 2 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 88 - 92 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3433, 3241, 2928,
1668, 1510.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz),
1.28 - 1.54 (8H, m), 1.62 (2H, m), 1.80 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
2.24 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.93 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.35 (2H, t, J = 7.2 Hz),

6.87 (1H, s), 7.33 (1H, m), 7.43 (1H, m), 7.81 (1H, m),
7.92 (1H, m), 8.72 (1H, br s).

実施例 3 2 (表中の化合物番号 8 3 1 の化合物)

2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミド

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 2 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 182 - 183°C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3148, 2928, 1674,
1524, 1412.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.21 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.22 (3H, t, J = 7.3 Hz), 2.41 (3H, s),
2.90 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.03 (2H, q, J = 7.3 Hz),
4.15 (2H, br s), 6.87 (1H, s), 7.08 - 7.12 (2H, m),
7.39 - 7.44 (2H, m).

EIMS m/z (relative intensity): 418 (M⁺), 357 (100).

元素分析 : C₁₉H₂₂N₄O₂S₃として

計算値 : C, 54.52; H, 5.30; N, 13.38.

実測値 : C, 54.44; H, 5.30; N, 13.16.

実施例 3 3 (表中の化合物番号 8 3 5 の化合物)

6-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 2 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 139 - 142°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3433, 3143, 2928,
1660, 1510.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.54 (2H, m),
1.68 (2H, m), 1.77 (2H, m), 2.28 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.27 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.87 (1H, s), 7.05 - 7.11 (2H, m),
7.27 - 7.52 (2H, m), 8.75 (1H, br s), 12.05 (1H, br s).

実施例 3 4 (表中の化合物番号 838 の化合物)

9-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 2 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 76 - 78°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3104, 2928, 2854,
1658, 1526.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz),
1.28 - 1.49 (8H, m), 1.61 (2H, m), 1.73 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
2.24 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.26 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.87 (1H, s),
7.05 - 7.10 (2H, m), 7.24 - 7.54 (2H, m), 8.71 (1H, br s),
12.05 (1H, br s).

実施例 3 5 (表中の化合物番号 841 の化合物)

2-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造：

ナトリウムイソプロポキシド (2.05 g, 25 mmol) の 2-ブロバノール (50 ml) 溶液に、氷冷下で 2-ブロパンチオール (1.90 g, 25 mmol) を滴下し 30 分間攪拌した。氷冷下のまま 2, 4-ジクロロ-6-メチル-3-ニトロピリジン (2.07 g, 10 mmol) の D M F (40 ml) 溶液をゆっくりと滴下した。2 時間攪拌後、反応混合物を酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して、2, 4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ニトロピリジン 2.77 g (収率 97 %) を黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (1.08 g, 3.77 mmol) を酢酸 (35 ml) と濃塩酸 (1.6 ml) の混合溶媒に溶解し、氷冷下で亜鉛 (2.96 g, 45.25 mmol) を少量ずつ加えた。1 時間攪拌後、反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、クロロホルムで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 30 : 1 → 10 : 1) で精製して 3-アミノ-2, 4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチルピリジン 774 mg (収率 80 %) を黄色油状物として得た。このアミノピリジン (774 mg, 3.02 mmol) の T H F (10 ml) 溶液にトリエチルアミン (336 mg, 3.32 mmol) を加え、次いで氷冷下でプロモ酢酸プロミド (732 mg, 3.62 mmol) をゆっくりと滴下し、17 時間攪拌した。反応混合物を濾過し濾液を濃縮した後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 10 : 1) で精製して 2-ブロモ-N-[2, 4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] アセトアミド 595 mg (収率 52 %) を無色粉末晶で得た。このアミド (132 mg, 0.35 mmol) と 2-メルカプトベンゾオキサゾール (53 mg, 0.35 mmol) のアセトニトリル (5 ml) 溶液に炭酸水素ナトリウム (29 mg, 0.35 mmol) を加え、室温で 28 時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、酢酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒；ヘキサン：ベンゼン = 6 : 1) で精製して目的化合物 69 mg (収率 44 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 99 - 101 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3437, 3241, 2967, 1659,

1 5 6 0 , 1 5 0 2 , 1 4 5 4 .

¹H - N M R (C D C l₃) δ :

1.19 (12H, d, J=6.8 Hz), 2.42 (3H, s),
 3.39 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 4.10 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.26 - 7.32 (2H, m), 7.48 (1H, m)
 7.61 (1H, m), 8.53 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 447(M⁺, 100).

実施例 3 6 (表中の化合物番号 8 4 5 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンアミドの製造 :

プロモ酢酸プロミドの代わりに 6 - プロモヘキサン酸クロリドを用いて実施例 3 5 と同様に反応・処理し、6 - プロモ - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンアミドを得た。このアミド (100 mg, 0.23 mmol) と 2 - メルカブトベンゾオキサゾール (35 mg, 0.23 mmol) の D M F (4 ml) 溶液に炭酸カリウム (38 mg, 0.28 mmol)、18 - クラウン - 6 (6 mg, 0.02 mmol) を加え、80 °Cで2.5時間攪拌した。反応混合物を放冷後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得た残渣を分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒 ; ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) で精製し目的化合物 92 mg (収率 79 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 98 - 100 °C

I R (K B r) cm⁻¹ : 3 1 3 5 , 2 9 6 1 , 1 6 4 8 ,
 1 4 9 8 , 1 4 5 4 , 1 1 3 3 .

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ :

1.32 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.35 (6H, d, J = 6.8 Hz),
 1.55 - 1.64 (2H, m), 1.65 - 1.75 (2H, m), 1.82 - 1.92 (2H, m),
 2.23 - 2.36 (2H, m), 2.46 (3H, s), 3.38 (2H, t, J = 7.1 Hz),

3.59 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 3.93 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz),
 6.96 (1H, s), 7.29 - 7.37 (2H, m), 7.57 - 7.64 (2H, m),
 8.95 (1H, br s).

実施例 37 (表中の化合物番号 1237 の化合物)

6-[オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イルチオ]-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造：
 6-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミド (100 mg, 0.27 mmol) と 2-メルカブトオキサゾロ[4,5-b]ピリジン (40 mg, 0.27 mmol) の DMF (4 ml) 溶液に 18-クラウン-6 (7 mg, 0.03 mmol) と 炭酸カリウム (40 mg, 0.29 mmol) を加え、80°Cで4時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を分取薄層クロマトグラフィー（展開溶媒；ヘキサン：アセトン=2:1）で精製して目的化合物 85 mg (収率 72 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 132 - 133 °C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3435, 3243, 2923, 1655,
 1493, 1404.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.53-1.63 (2H, m), 1.65-1.76 (2H, m), 1.83-1.93 (2H, m),
 2.27-2.35 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
 3.40 (2H, t, $J=7.3$ Hz), 6.86 (1H, s),
 7.30 (1H, dd, $J=8.1, 4.9$ Hz), 7.97 (1H, dd, $J=8.1, 1.3$ Hz),
 8.42 (1H, dd, $J=4.9, 1.3$ Hz), 8.83 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity) : 447(M⁺-1), 400(100).

元素分析 : C₂₀H₂₄N₄O₂S₃として

計算値 : C, 53.55; H, 5.39; N, 12.59; S, 21.44.

実測値 : C, 53.72; H, 5.39; N, 12.41; S, 21.51.

実施例 3 8 (表中の化合物番号 1 2 3 8 の化合物)

6 - (7 - メトキシカルボニルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンアミドの製造 :

2 - メルカブトオキサゾロ [4, 5 - b] ピリジンの代わりに 7 - メトキシカルボニル - 2 - メルカブトベンゾオキサゾールを用いて実施例 3 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 141 - 142 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3425, 3236, 2923, 1726,
1667, 1509.

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.54-1.63 (2H, m), 1.67-1.76 (2H, m), 1.84-1.93 (2H, m),
2.28-2.35 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
3.39 (2H, t, J=7.1Hz), 3.95 (3H, s), 6.86 (1H, s),
7.44 (1H, t, J=7.8Hz), 7.81 (1H, dd, J=7.8, 1.2Hz),
7.85 (1H, dd, J=7.8, 1.2Hz), 8.82 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 504(M⁺-1), 167(100).

元素分析 : C₂₃H₂₇N₃O₄S₃として

計算値 : C, 54.63; H, 5.38; N, 8.31; S, 19.02.

実測値 : C, 54.70; H, 5.37; N, 8.27; S, 19.15.

実施例 3 9 (表中の化合物番号 1 2 4 0 の化合物)

9 - (7 - メトキシカルボニルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造 :

9 - ブロモ - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミド (90 mg, 0.22 mmol) と 7 - メトキシカルボニル - 2 - メルカブトベンゾオキサゾール (45 mg, 0.22 mmol) の D M F (4 ml) 溶液に 18 - クラウン - 6 (6 mg, 0.02 mmol) と 炭酸カリウム (36 mg, 0.26 mmol) を加え、8

0 ℃で4時間攪拌した。反応混合物を水で希釈後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得た粗生成物を酢酸エチルへキサンより再結晶し、目的化合物 84 mg (収率 72 %) を無色粉末晶として得た。

融点 : 126 - 128 ℃

IR (KBr) cm⁻¹ : 3231, 2924, 1720,
1657, 1508, 1297.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27-1.47 (8H, m), 1.54-1.62 (2H, m), 1.74-1.85 (2H, m),
2.24 (2H, t, J=7.3Hz), 2.37 (3H, s), 2.38 (3H, s), 2.43 (3H, s),
3.31-3.41 (2H, m), 3.91 (3H, s), 6.86 (1H, s),
7.45 (1H, t, J=7.8Hz), 7.81 (1H, dd, J=7.8, 1.0Hz),
7.91 (1H, dd, J=7.8, 1.0Hz), 9.26 (1H, s).

EIMS m/z (relative intensity) : 546(M⁺-1), 500(100).

元素分析 : C₂₆H₃₃N₃O₄S₃として

計算値 : C, 57.01; H, 6.07; N, 7.67; S, 17.56.

実測値 : C, 57.10; H, 5.95; N, 7.67; S, 17.60.

実施例 40 (表中の化合物番号 151 の化合物)

2-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)アセトアミドの製造:

3-アミノ-2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジンを用いて実施例 16 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 146 - 148 ℃

IR (KBr) cm⁻¹: 3437, 3245, 1671, 1659,
1507, 1454.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

2.17 (3H, s), 2.42 (3H, s), 4.11 (2H, s),

6.87 (1H, d, J = 4.9 Hz),
 7.28 - 7.34 (2H, m), 7.50 (1H, m), 7.61 (1H, m),
 8.23 (1H, d, J = 4.9 Hz), 8.88 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 345 (M⁺, 100).

元素分析 : C₁₆H₁₅N₃O₂S₂として

計算値 : C, 55.63; H, 4.38; N, 12.16; S, 18.56...

実測値 : C, 55.66; H, 4.46; N, 12.02; S, 18.55.

実施例 4 1 (表中の化合物番号 155 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(4-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミドの製造 :

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジンを用いて実施例 18 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 122 - 124°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3437, 3245, 1660, 1521,
 1507, 1133.

¹H-N M R (d₆-DMSO) δ :

1.49 - 1.56 (2H, m), 1.68 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
 1.84 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.09 (3H, s),
 2.33 (2H, t, J = 7.4 Hz), 2.40 (3H, s), 3.36 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 7.02 (1H, d, J = 4.9 Hz), 7.29 - 7.36 (2H, m), 7.61 - 7.66 (2H, m),
 8.24 (1H, d, J = 4.9 Hz), 9.40 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 401 (M⁺, 100).

元素分析 : C₂₀H₂₃N₃O₂S₂として

計算値 : C, 59.82; H, 5.77; N, 10.46; S, 15.97.

実測値 : C, 59.93; H, 5.89; N, 10.34; S, 15.99.

実施例 4 2 (表中化合物番号 365 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(6-メトキシ-2-メチルチオ-3-ピリジル)ヘキサンアミドの製造：

ナトリウムチオメトキシド(805 mg, 10.9 mmol)のメタノール溶液(20 ml)に、氷冷下で2-クロロ-6-メトキシ-3-ニトロピリジン(2.0 g, 10.4 mmol)のメタノール溶液(100 ml)を滴下し、室温に昇温して17時間搅拌後、析出した結晶を濾取して、6-メトキシ-2-メチルチオ-3-ニトロピリジン 1.26 g(収率 59%)を黄色粉末晶として得た。

このニトロピリジン(400 mg, 2.0 mmol)を酢酸(20 ml)と濃塩酸(0.5 ml)の混合溶媒に懸濁し、氷冷下で亜鉛(1.57 g, 24.0 mmol)を少量ずつ加えた。氷冷下で5分間搅拌し、室温で40分間搅拌後反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗净し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒：ヘキサン：酢酸エチル = 6 : 1 → 4 : 1)で精製して、3-アミノ-6-メトキシ-2-メチルチオピリジン 264 mg(収率 78%)を淡褐色粉末晶として得た。

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-6-メトキシ-2-メチルチオピリジンを用いて実施例18と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点：102-104°C

IR(KBr) cm⁻¹: 3430, 3224, 2940, 1652,
1591.

¹H-NMR(CDCl₃) δ:

1.61(2H, quint, J = 7.4 Hz), 1.82(2H, quint, J = 7.4 Hz),
1.92(2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.42(2H, t, J = 7.4 Hz),
2.59(3H, s), 3.34(2H, t, J = 7.4 Hz), 3.94(3H, s),
6.47(1H, d, J = 8.5 Hz), 6.91(1H, br s),
7.23(1H, td, J = 7.7, 1.5 Hz), 7.27(1H, td, J = 7.7, 1.5 Hz),
7.43(1H, dd, J = 7.7, 1.5 Hz), 7.58(1H, dd, J = 7.7, 1.5 Hz),
7.93(1H, d, J = 8.5 Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 417 (M⁺), 171 (100).

実施例 4 3 (表中の化合物番号 4 5 1 の化合物)

2-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)アセトアミドの製造:

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-6-メチル-2-メチルチオピリジンを用いて実施例 1 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 180-181°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3437, 3254, 1661, 1534,
1509, 1135.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

2.46 (3H, s), 2.50 (3H, s), 4.10 (2H, s), 6.87 (2H, d, J = 8.1 Hz),
7.26 - 7.34 (2H, m), 7.48 (1H, m), 7.62 (1H, m),
8.12 (2H, d, J = 8.1 Hz), 9.27 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 345 (M⁺), 298 (100).

元素分析 : C₁₀H₁₅N₃O₂S₂として

計算値 : C, 55.63; H, 4.38; N, 12.16; S, 18.56.

実測値 : C, 55.62; H, 4.40; N, 12.10; S, 18.50.

実施例 4 4 (表中の化合物番号 4 6 1 の化合物)

2-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)アセトアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 4 3 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 175-176°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3437, 3248, 1656, 1532,
1430.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

2.45 (3H, s), 2.47 (3H, s), 4.18 (2H, s), 6.87 (1H, d, J = 8.1 Hz),
7.34 (1H, m), 7.44 (1H, m), 7.77 (1H, m), 8.01 (1H, m),
8.07 (1H, d, J = 8.1 Hz), 9.31 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 361 (M⁺), 210 (100).

元素分析 : C₁₆H₁₅N₃O₂S₃として

計算値 : C, 53.16; H, 4.18; N, 11.62; S, 26.61.

実測値 : C, 53.23; H, 4.25; N, 11.55; S, 26.67.

実施例 4 5 (表中の化合物番号 471 の化合物)

2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-(6-メチル-2-メチルチオ-3-ピリジル)アセトアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 4 3 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 192-193°C (d.)

IR (KBr) cm⁻¹: 3420, 3249, 1667, 1550,
1438, 744.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

2.45 (3H, s), 2.50 (3H, s), 4.08 (2H, s), 6.84 (1H, d, J = 8.1 Hz),
7.19 - 7.25 (2H, m), 7.35 (1H, m), 7.73 (1H, m),
8.00 (1H, d, J = 8.1 Hz), 9.95 (1H, br s), 10.00 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 344 (M⁺), 118 (100).

元素分析 : C₁₆H₁₆N₄O₂S₂として

計算値 : C, 55.79; H, 4.68; N, 16.27; S, 18.62.

実測値 : C, 55.80; H, 4.68; N, 16.16; S, 18.65.

実施例 4 6 (表中の化合物番号 784 の化合物)

5-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチ

オ) -6-メチル-3-ピリジル] ペンタンアミドの製造：

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに5-ブロモペンタン酸クロリドを用いて実施例17と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点：147-150°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3230, 1664, 1501, 1455,
1136.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.72-1.96 (4H, m), 2.36 (3H, s), 2.26-2.42 (2H, m),
2.39 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.36 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.83 (1H, s),
7.23-7.33 (2H, m), 7.52-7.59 (2H, m), 8.74 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 433 (M⁺), 201 (100).

実施例47(表中の化合物番号786の化合物)

7-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造：

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに7-ブロモヘプタン酸クロリドを用いて実施例17と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点：137-139°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3437, 3242, 2922, 2857,
1660, 1500, 1455, 1132.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.41-1.54 (4H, m), 1.60-1.70 (2H, m),
1.81 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.26-2.32 (2H, m), 2.38 (3H, s),
2.40 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.33 (2H, t, J = 7.1 Hz),
6.81 (1H, s), 7.27 (1H, td, J = 7.6, 1.7 Hz),
7.30 (1H, td, J = 7.6, 1.7 Hz), 7.54-7.60 (2H, m),
8.79 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 461 (M⁺), 200 (100).

実施例 4 8 (表中の化合物番号 7 8 7 の化合物)

8 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] オクタンアミドの製造：

4-ブロモブタン酸クロリドの代わりに8-ブロモオクタン酸クロリドを用いて実施例 1 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色ブリズム晶として得た。

融点： 119 - 122°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3435, 3248, 2923, 2856,
1660, 1501, 1454, 1131.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.33 - 1.52 (6H, m), 1.58 - 1.69 (2H, m),
1.81 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.26 - 2.32 (2H, m), 2.38 (3H, s),
2.41 (3H, s), 2.44 (3H, s), 3.33 (2H, t, J = 7.1 Hz),
6.84 (1H, s), 7.27 (1H, td, J = 7.6, 1.7 Hz),
7.30 (1H, td, J = 7.6, 1.7 Hz), 7.54 - 7.60 (2H, m),
8.77 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 475 (M⁺), 200 (100).

実施例 4 9 (表中の化合物番号 7 9 1 の化合物)

2 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] アセトアミドの製造：

炭酸水素ナトリウム (17 mg, 0.2 mmol) と2-メルカプトベンゾチアゾール (34 mg, 0.2 mmol) のアセトニトリル溶液 (1 ml) に2-ブロモ-N - [2, 4-ビス(メチルチオ) - 3-ピリジル] アセトアミド (64 mg, 0.2 mmol) のアセトニトリル溶液 (6 ml) を加え、室温で48時間攪拌した。反応混合液を減圧濃縮し、この残渣を水で希釈後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、分取薄層クロマトグラフィー (展開溶媒；クロロホルム : メタノール = 200 : 1) で精製して、目的化合物46 mg (収率 33 %) を無色針状晶として得た。

融点： 178 - 179°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3437, 3246, 1665, 1564,
1497, 1430.

¹H-NMR (CDCl₃) δ:

2.33 (3H, s), 2.44 (3H, s), 2.46 (3H, s), 4.17 (2H, s),
6.61 (1H, s), 7.33 (1H, m), 7.43 (1H, m), 7.78 (1H, m),
7.90 (1H, m), 9.11 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 407 (M⁺), 209 (100).

元素分析: C₁₁H₁₃N₃O₂S₄として

計算値: C, 50.10; H, 4.20; N, 10.31; S, 31.46.

実測値: C, 50.18; H, 4.29; N, 10.23; S, 31.49.

実施例 5 0 (表中の化合物番号 7 9 4 の化合物)

5-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタシアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 4 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点: 121-123°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3437, 3240, 2923, 1664,
1515, 1456, 1428, 995.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.78 - 1.87 (2H, m), 1.88 - 1.96 (2H, m), 2.30 - 2.40 (2H, m),
2.38 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.41 (2H, t, J = 7.1 Hz),
6.85 (1H, s), 7.34 (1H, t, J = 7.6 Hz), 7.45 (1H, t, J = 7.6 Hz),
7.84 (1H, d, J = 7.6 Hz), 7.94 (1H, d, J = 7.6 Hz),
8.87 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 449 (M⁺), 201 (100).

実施例 5 1 (表中の化合物番号 7 9 6 の化合物)

7-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチ

オ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造：

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 4 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 129 - 130 °C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3436, 3245, 2922, 1661,
1506, 1428.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.44 - 1.54 (4H, m), 1.62 - 1.71 (2H, m),
1.83 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.13 - 2.33 (2H, m), 2.39 (3H, s),
2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s), 3.37 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.86 (1H, s),
7.34 (1H, td, J = 7.8, 1.2 Hz), 7.45 (1H, td, J = 7.8, 1.2 Hz),
7.84 (1H, dd, J = 7.8, 1.2 Hz), 7.94 (1H, dd, J = 7.8, 1.2 Hz),
8.81 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity) : 477 (M⁺), 200 (100).

元素分析 : C₂₂H₂₇N₃O₂S₄として

計算値 : C, 55.31; H, 5.70; N, 8.80.

実測値 : C, 55.41; H, 5.71; N, 8.64.

実施例 5 2 (表中の化合物番号 797 の化合物)

8 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造：

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 4 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 104 - 108 °C

IR (KBr) cm⁻¹ : 3242, 2925, 1665, 1508,
1459, 1428.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.30 - 1.51 (6H, m), 1.55 - 1.69 (2H, m),
 1.81 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.23 - 2.29 (2H, m),
 2.38 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.44 (3H, s), 3.35 (2H, t, J = 7.2 Hz)
 6.83 (1H, s), 7.32 (1H, m), 7.43 (1H, m), 7.81 (1H, m),
 7.91 (1H, m), 8.76 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 491 (M⁺), 200 (100).

実施例 5 3 (表中の化合物番号 801 の化合物)

2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカブトベンゾチアゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例49と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 235 - 237°C (d.)

I R (KBr) cm⁻¹: 3429, 3243, 2978, 2923,
 1661, 1505, 1439.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

2.35 (3H, s), 2.46 (3H, s), 2.47 (3H, s), 4.03 (2H, s),
 6.63 (1H, s), 7.21 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.22 (1H, t, J = 6.1 Hz),
 7.43 - 7.60 (2H, m), 9.43 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 390 (M⁺), 344 (100).

実施例 5 4 (表中の化合物番号 804 の化合物)

5-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例46と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 176 - 177°C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.74 - 1.84 (4H, m), 2.26 - 2.35 (2H, m), 2.36 (3H, s),
 2.39 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.26 - 3.36 (2H, m), 6.84 (1H, s),
 7.04 - 7.13 (2H, m), 7.34 - 7.45 (2H, m), 8.84 (1H, br s),
 12.06 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 432 (M⁺), 200 (100).

実施例 5 5 (表中の化合物番号 806 の化合物)

7 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 4 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 189 - 192 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3139, 2925, 2854, 1668,
 1561, 1523, 1435, 1401.

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.39 - 1.52 (4H, m), 1.56 - 1.70 (2H, m),
 1.75 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.28 - 2.34 (2H, m), 2.38 (3H, s),
 2.40 (3H, s), 2.43 (3H, s), 3.27 (2H, t, J = 7.1 Hz),
 6.84 (1H, s), 7.07 (1H, t, J = 7.1 Hz), 7.08 (1H, t, J = 7.1 Hz),
 7.32 (1H, d, J = 7.1 Hz), 7.46 (1H, d, J = 7.1 Hz),
 8.79 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 460 (M⁺), 150 (100).

実施例 5 6 (表中の化合物番号 807 の化合物)

8 - (ベンゾイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾイミダゾールを用いて実施例 4 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得

た。

融点 : 186 - 187 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3430, 3222, 2925, 1661,
1564, 1522, 1437, 808.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.35 - 1.43 (4H, m), 1.47 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
1.60 - 1.68 (2H, m), 1.76 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
2.23 - 2.32 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s),
3.28 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.89 (1H, s), 7.09 (1H, t, J = 5.9 Hz),
7.09 (1H, t, J = 5.9 Hz), 7.40 (1H, d, J = 5.9 Hz),
7.41 (1H, d, J = 5.9 Hz), 8.80 (1H, br s). 12.09 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 474 (M⁺), 150 (100).

実施例 5 7 (表中の化合物番号 813 の化合物)

4-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

6-プロモヘキサン酸クロリドの代わりに4-プロモブタン酸クロリドを用いて実施例 2 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 123 - 125 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3436, 3239, 2974, 2929,
1656, 1502, 1454, 1130.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.23 - 1.28 (6H, m), 2.12 - 2.19 (2H, m), 2.43 (3H, s),
2.48 - 2.50 (2H, m), 2.93 (2H, q, J = 7.1 Hz),
3.06 (2H, q, J = 7.1 Hz), 3.41 - 3.48 (2H, m), 6.89 (3H, s),
7.29 - 7.34 (2H, m), 7.56 - 7.62 (2H, m), 8.96 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 447 (M⁺), 227 (100).

実施例 5 8 (表中の化合物番号 814 の化合物)

5 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ベンタンアミドの製造：

6 - プロモヘキサン酸クロリドの代わりに 5 - プロモベンタン酸クロリドを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点：122 - 123°C.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.76 - 1.87 (2H, m), 1.87 - 1.97 (2H, m),
 2.29 - 2.40 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.38 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.88 (1H, s),
 7.26 - 7.35 (2H, m), 7.55 - 7.60 (2H, m), 8.82 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 461 (M⁺), 227 (100).

実施例 59 (表中の化合物番号 816 の化合物)

7 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造：

6 - プロモヘキサン酸クロリドの代わりに 7 - プロモヘプタン酸クロリドを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点：103 - 105°C.

IR (KBr) cm⁻¹: 3247, 1663, 1501, 1455.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.38 - 1.54 (4H, m), 1.57 - 1.72 (2H, m), 1.73 - 1.89 (2H, m),
 2.19 - 2.32 (2H, m), 2.41 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.33 (2H, t, J = 7.1 Hz), 6.86 (1H, s),
 7.24 - 7.32 (2H, m), 7.52 - 7.60 (2H, m), 8.65 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 489 (M⁺), 228 (100).

実施例 60 (表中の化合物番号 817 の化合物)

8 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造 :

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 8 - ブロモオクタン酸クロリドを用いて実施例 27 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 82 - 84°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3449, 3245, 2932, 1669,
1500, 1455, 1132.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz),
1.37 - 1.42 (4H, m), 1.48 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
1.60 - 1.67 (2H, m), 1.82 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
2.24 - 2.30 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.07 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.34 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.88 (1H, s),
7.27 - 7.33 (2H, m), 7.56 - 7.61 (2H, m), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 503 (M⁺), 229 (100).

実施例 61 (表中化合物番号 823 の化合物)

4 - (ベンゾチアゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] プタンアミドの製造 :

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 57 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 119 - 120°C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.4 Hz),
2.07 - 2.23 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.45 - 2.55 (2H, m),
2.93 (2H, q, J = 7.4 Hz), 3.06 (2H, q, J = 7.4 Hz),
3.41 - 3.54 (2H, m), 6.89 (1H, s), 7.35 (1H, t, J = 8.1 Hz),
7.45 (1H, t, J = 8.1 Hz), 7.83 (1H, d, J = 8.1 Hz).

7.94 (1H, d, J = 8.1 Hz), 8.95 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 463 (M⁺), 229 (100).

実施例 6 2 (表中の化合物番号 8 2 4 の化合物)

5 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ) - 6 - メチル-3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 5 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 102 - 104 °C

¹H - N M R (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.77 - 1.88 (2H, m), 1.88 - 2.00 (2H, m), 2.29 - 2.41 (2H, m),
 2.43 (3H, s), 2.93 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.06 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.41 (2H, t, J = 7.0 Hz), 6.89 (1H, s),
 7.35 (1H, ddd, J = 8.2, 7.2, 1.2 Hz),
 7.45 (1H, ddd, J = 8.2, 7.2, 1.2 Hz),
 7.84 (1H, dd, J = 8.2, 1.2 Hz), 7.94 (1H, dd, J = 8.2, 1.2 Hz),
 8.84 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 477 (M⁺), 229 (100).

実施例 6 3 (表中の化合物番号 8 2 6 の化合物)

7 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ) - 6 - メチル-3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2 - メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 5 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 114 - 116 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3245, 1665, 1536, 1509,

1 4 2 6 .

¹H - N M R (d₆-D M S O) δ :

1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.39 - 1.56 (4H, m), 1.58 - 1.71 (2H, m), 1.75 - 1.88 (2H, m),
 2.19 - 2.31 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.35 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.86 (1H, s),
 7.32 (1H, td, J = 7.6, 1.2 Hz), 7.42 (1H, td, J = 7.6, 1.2 Hz),
 7.81 (1H, dd, J = 7.6, 1.2 Hz), 7.91 (1H, dd, J = 7.6, 1.2 Hz),
 8.67 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 505 (M⁺), 227 (100).

実施例 6 4 (表中の化合物番号 8 2 7 の化合物)

8 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] オクタノンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 6 0 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 94 - 96 °C

I R (K B r) cm⁻¹: 3433, 3243, 2929, 1669,
 1511, 1428.

¹H - N M R (d₆-D M S O) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.37 - 1.43 (4H, m), 1.45 - 1.52 (2H, m), 1.57 - 1.68 (2H, m),
 1.82 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.20 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.07 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.37 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.88 (1H, s),
 7.34 (1H, td, J = 7.6, 1.1 Hz), 7.44 (1H, td, J = 7.6, 1.1 Hz),
 7.83 (1H, dd, J = 7.6, 1.1 Hz), 7.93 (1H, dd, J = 7.6, 1.1 Hz),
 8.73 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 519 (M⁺), 227 (100).

実施例 6 5 (表中の化合物番号 8 3 3 の化合物)

4 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ブタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 5 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色粉末晶として得た。

融点 : 160 - 161 °C

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 2.27 - 2.37 (2H, m), 2.44 (3H, s),
 2.48 - 2.50 (2H, m), 2.93 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.06 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.34 - 3.46 (2H, m), 6.89 (1H, s),
 7.05 - 7.14 (2H, m), 7.33 (1H, m), 7.46 (1H, m), 8.95 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 446 (M⁺), 195 (100).

実施例 6 6 (表中の化合物番号 8 3 4 の化合物)

5 - (ベンズイミダゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 5 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 163 - 165 °C

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ :

1.23 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.74 - 1.88 (4H, m), 2.27 - 2.38 (2H, m),
 2.41 (3H, s), 2.90 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.03 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.26 - 3.34 (2H, m), 6.86 (1H, s), 7.04 - 7.11 (2H, m),

7.32 (1H, m), 7.46 (1H, m), 8.79 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 460 (M⁺), 195 (100).

実施例 6 7 (表中の化合物番号 8 3 6 の化合物)

7 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 5 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 151 - 156 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3136, 3106, 1656, 1518,
1438, 1401, 1337, 1268.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz),
1.36 - 1.54 (4H, m), 1.55 - 1.82 (4H, m), 2.15 - 2.32 (2H, m),
2.41 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.26 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.86 (1H, s),
7.03 - 7.11 (2H, m), 7.34 - 7.44 (2H, m), 8.67 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 488 (M⁺), 151 (100).

実施例 6 8 (表中の化合物番号 8 3 7 の化合物)

8 - (ベンゾイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] オクタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾイミダゾールを用いて実施例 6 0 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 166 - 168 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3427, 3147, 2928, 1660,
1560, 1526, 1437.

¹H - N M R (d₆-DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.36 - 1.41 (4H, m), 1.47 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
 1.60 - 1.67 (2H, m), 1.75 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
 2.22 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.07 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.28 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.88 (1H, s),
 7.08 (1H, t, J = 5.9 Hz), 7.09 (1H, t, J = 5.9 Hz),
 7.40 (1H, d, J = 5.9 Hz), 7.41 (1H, d, J = 5.9 Hz),
 8.73 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 502 (M⁺), 151 (100).

実施例 6 9 (表中の化合物番号 8 4 3 の化合物)

4-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソブロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

6-ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに4-ブロモブタン酸クロリドを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 128 - 129 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3448, 3235, 2962, 1683,
 1657, 1555, 1515, 1500;
 1456, 1131.

¹H - N M R (d₆-DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.6 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
 2.10 - 2.17 (2H, m), 2.42 (3H, s),
 2.47 - 2.50 (2H, m), 3.39 - 3.47 (2H, m),
 3.55 (1H, sept, J = 6.6 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 6.92 (1H, s), 7.28 (1H, td, J = 7.3, 1.7 Hz),
 7.30 (1H, td, J = 7.3, 1.7 Hz), 7.56 (1H, dd, J = 7.3, 1.7 Hz),
 7.58 (1H, dd, J = 7.3, 1.7 Hz), 8.90 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 475 (M⁺), 207 (100).

実施例 7 0 (表中の化合物番号 8 4 4 の化合物)

5 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造 :

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 5 - ブロモペンタン酸クロリドを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色プリズム晶として得た。

融点 : 129 - 130 ℃

I R (KBr) cm⁻¹ : 3448, 3215, 3167, 2965,
1654, 1555, 1525, 1500,
1454, 1128.

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.75 - 1.85 (2H, m), 1.86 - 1.96 (2H, m), 2.26 - 2.40 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.37 (2H, t, J = 7.1 Hz),
3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.27 (1H, td, J = 7.6, 1.7 Hz),
7.30 (1H, td, J = 7.6, 1.7 Hz), 7.55 (1H, dd, J = 7.6, 1.7 Hz),
7.58 (1H, dd, J = 7.6, 1.7 Hz), 8.75 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 489 (M⁺), 221 (100).

実施例 7 1 (表中の化合物番号 8 4 6 の化合物)

7 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造 :

6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 7 - ブロモヘプタン酸クロリドを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 76 - 78 ℃

I R (KBr) cm⁻¹ : 3436, 3265, 2929, 1663,
1503, 1455.

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.32 (6H, d, J = 6.8 Hz),
 1.43 - 1.54 (4H, m), 1.65 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
 1.83 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.20 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 3.35 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.56 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.90 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.93 (1H, s), 7.27 - 7.34 (2H, m),
 7.56 - 7.61 (2H, m), 8.72 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 517 (M⁺), 249 (100).

実施例 7 2 (表中の化合物番号 8 4 7 の化合物)

8 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソブロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造：
 6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 8 - ブロモオクタン酸クロリドを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色油状物として得た。

I R (K B r) cm⁻¹: 3241, 1664, 1559, 1526,
 1501, 1454.

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ :

1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
 1.34 - 1.54 (6H, m), 1.55 - 1.69 (2H, m), 1.73 - 1.89 (2H, m),
 2.15 - 2.28 (2H, m), 2.42 (3H, s), 3.27 (2H, t, J = 7.3 Hz),
 3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 6.90 (1H, s), 7.24 - 7.32 (2H, m), 7.51 - 7.60 (2H, m),
 8.59 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 531 (M⁺), 263 (100).

実施例 7 3 (表中の化合物番号 8 4 8 の化合物)

9 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソブロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造：
 6 - ブロモヘキサン酸クロリドの代わりに 9 - ブロモノナン酸クロリドを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

I R (C a p) c m⁻¹: 3 2 4 3, 2 9 6 2, 2 9 2 7, 1 6 6 8,
1 5 5 8, 1 5 0 5, 1 4 5 5, 1 1 3 0.

¹H-N M R (d₆-D.M S O) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.28 - 1.50 (8H, m), 1.55 - 1.65 (2H, m),
1.80 (2H, quint, J = 7.3 Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.32 (2H, t, J = 7.3 Hz),
3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.27 (1H, td, J = 7.3, 1.7 Hz),
7.30 (1H, td, J = 7.3, 1.7 Hz), 7.54 - 7.60 (2H, m),
8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 545 (M⁺), 277 (100).

実施例 7 4 (表中の化合物番号 8 5 1 の化合物)

2-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの代わりに2-ブロモ-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドを用いて実施例 4 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 117 - 118°C

I R (K B r) c m⁻¹: 3 4 3 1, 3 1 7 9, 2 9 6 7, 1 6 6 0,
1 5 5 9, 1 5 2 6, 1 4 2 8.

¹H-N M R (C D C l₃) δ :

1.19 (6H, d, J = 6.7 Hz), 1.21 (6H, d, J = 6.7 Hz), 2.41 (3H, s),
3.39 (1H, sept, J = 6.7 Hz), 3.92 (1H, sept, J = 6.7 Hz),
4.18 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.32 (1H, td, J = 7.7, 1.2 Hz),
7.41 (1H, td, J = 7.7, 1.2 Hz), 7.77 (1H, d, J = 7.7 Hz),
7.91 (1H, d, J = 7.7 Hz), 8.80 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 463 (M⁺), 180 (100).

元素分析 : C₂₁H₂₅N₃O₄Sとして

計算値 : C, 54.39; H, 5.43; N, 9.06; S, 27.66.

実測値 : C, 54.28; H, 5.45; N, 8.93; S, 27.73.

実施例 7 5 (表中の化合物番号 853 の化合物)

4-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタシアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 6 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 116-117°C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3450, 3257, 2962, 1667,
1557, 1510, 1457, 1429,
987.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
2.08 - 2.17 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.43 - 2.47 (2H, m), 3.45 (2H, t, J = 7.1 Hz),
3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.92 (1H, s), 7.33 (1H, t, J = 7.8 Hz),
7.43 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.81 (1H, d, J = 7.8 Hz),
7.92 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.90 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity) : 491 (M⁺), 69 (100).

実施例 7 6 (表中の化合物番号 854 の化合物)

5-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ベンタシアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾ

ルを用いて実施例 70 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 107 - 109 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3441, 3215, 2963, 1656,
1557, 1523, 1460, 1429,
996.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.76 - 1.85 (2H, m), 1.86 - 1.96 (2H, m), 2.26 - 2.40 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.39 (2H, t, J = 7.1 Hz),
3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.33 (1H, td, J = 8.1, 1.2 Hz),
7.43 (1H, td, J = 8.1, 1.2 Hz), 7.82 (1H, dd, J = 8.1, 1.2 Hz),
7.92 (1H, dd, J = 8.1, 1.2 Hz), 8.75 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 505 (M⁺), 221 (100).

実施例 77 (表中の化合物番号 855 の化合物)

6-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 36 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 84 - 86 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3436, 3212, 2961, 2925,
1655, 1555, 1522, 1428.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.30 (6H, d, J = 6.6 Hz), 1.33 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.54 - 1.62 (2H, m), 1.65 - 1.73 (2H, m),
1.85 (2H, quint, J = 7.0 Hz), 2.22 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
3.38 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.57 (1H, sept, J = 6.6 Hz).

3.91 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.93 (1H, s), 7.34 (1H, t, $J = 7.8$ Hz),
 7.44 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.83 (1H, d, $J = 7.8$ Hz),
 7.93 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 8.73 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 519 (M^+), 235 (100).

実施例 7 8 (表中の化合物番号 856 の化合物)

7 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(イソブロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] ヘプタンアミドの製造:
 2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 7 1 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 74 - 76 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3436, 3200, 3158, 2961,
 2928, 1654, 1525, 1427.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.29 (6H, d, $J = 6.6$ Hz), 1.32 (6H, d, $J = 6.8$ Hz),
 1.43 - 1.55 (4H, m), 1.65 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz),
 1.83 (2H, quint, $J = 7.2$ Hz), 2.22 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 3.37 (2H, t, $J = 7.2$ Hz), 3.56 (1H, sept, $J = 6.6$ Hz),
 3.90 (1H, sept, $J = 6.8$ Hz), 6.93 (1H, s),
 7.34 (1H, td, $J = 7.7, 1.2$ Hz), 7.44 (1H, td, $J = 7.7, 1.2$ Hz),
 7.83 (1H, dd, $J = 7.7, 1.2$ Hz), 7.94 (1H, dd, $J = 7.7, 1.2$ Hz),
 8.68 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 533 (M^+), 249 (100).

実施例 7 9 (表中の化合物番号 857 の化合物)

8 - (ベンゾチアゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(イソブロピルチオ) - 6-メチル-3-ピリジル] オクタンアミドの製造:
 2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンゾチアゾールを用いて実施例 7 2 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得

た。

融点 : 107 - 108 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3239, 1664, 1559, 1526,
1456, 1428.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.34 - 1.54 (6H, m), 1.55 - 1.70 (2H, m), 1.73 - 1.88 (2H, m),
2.15 - 2.29 (2H, m), 2.42 (3H, s), 3.35 (2H, t, J = 7.3 Hz),
3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.90 (1H, s), 7.31 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.42 (1H, t, J = 7.8 Hz),
7.81 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.90 (1H, d, J = 7.8 Hz),
8.59 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 547 (M⁺), 263 (100).

実施例 80 (表中の化合物番号 858 の化合物)

9-(ベンゾチアゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンゾチアゾールを用いて実施例73と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

I R (Cap) cm⁻¹: 3243, 2962, 2927, 1668,
1559, 1526, 1456.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.28 - 1.50 (8H, m), 1.55 - 1.65 (2H, m),
1.80 (2H, quint, J = 7.0 Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.34 (2H, t, J = 7.0 Hz),
3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.32 (1H, td, J = 7.1, 1.2 Hz),

7.43 (1H, td, J = 7.1, 1.2 Hz), 7.81 (1H, dd, J = 7.1, 1.2 Hz),
7.91 (1H, dd, J = 7.1, 1.2 Hz), 8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 561 (M⁺), 277 (100).

実施例 8 1 (表中の化合物番号 8 6 1 の化合物)

2-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-メチルピリジル]アセトアミドの代わりに2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドを用いて実施例 5 3 と同様に反応・処理し、目的の化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 223-224°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3437, 3138, 3106, 2960,
1668, 1534, 1414.

¹H-NMR (CDC13) δ :

1.22 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.42 (3H, s),
3.41 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.95 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
4.05 (2H, s), 6.69 (1H, s), 7.18 (1H, t, J = 6.1 Hz),
7.19 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.34 (1H, br s), 7.62 (1H, br s),
9.33 (1H, br s), 10.61 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 446 (M⁺), 371 (100).

元素分析 : C₂₁H₂₆N₄O₂S₃として

計算値 : C, 56.47; H, 5.87; N, 12.54.

実測値 : C, 56.42; H, 5.87; N, 12.56.

実施例 8 2 (表中の化合物番号 8 6 3 の化合物)

4-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾ

ールを用いて実施例 6 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色粉末晶として得た。

融点 : 209 - 211°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3480, 3196, 2963, 1664,
1557, 1529, 1428.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz),
2.04 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.43 (3H, s),
2.44 (2H, t, J = 7.1 Hz), 3.36 (2H, t, J = 7.1 Hz),
3.61 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.86 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.96 (1H, s), 7.09 (1H, dd, J = 7.3, 5.4 Hz),
7.12 (1H, dd, J = 7.3, 5.4 Hz), 7.35 (1H, m), 7.49 (1H, m),
9.38 (1H, s), 12.53 (1H, s).

E I M S m/z (relative intensity): 474 (M⁺), 207 (100).

実施例 8 3 (表中の化合物番号 8 6 4 の化合物)

5-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソブロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 7 0 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 175 - 176°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3447, 3195, 2965, 1663,
1557, 1526, 1428, 1400.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.75 - 1.90 (4H, m), 2.26 - 2.38 (2H, m), 2.42 (3H, s),
3.30 (2H, t, J = 7.1 Hz), 3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.91 (1H, s),

7.07 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.08 (1H, t, J = 6.1 Hz),

7.32 (1H, d, J = 6.1 Hz), 7.46 (1H, d, J = 6.1 Hz),

8.72 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 488 (M⁺), 221 (100).

実施例 8 4 (表中化合物番号 8 6 5 の化合物)

6 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル-3 - ピリジル] ヘキサンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 3 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 175 - 176 °C

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ :

1.30 (6H, d, J = 6.7 Hz), 1.32 (6H, d, J = 6.7 Hz),

1.47 - 1.61 (2H, m), 1.62 - 1.72 (2H, m),

1.73 - 1.84 (2H, m), 2.18 - 2.35 (2H, m),

2.43 (3H, s), 3.21 - 3.33 (2H, m), 3.55 (1H, sept, J = 6.7 Hz),

3.90 (1H, sept, J = 6.7 Hz), 6.92 (1H, s),

7.03 - 7.12 (2H, m), 7.33 (1H, m), 7.47 (1H, m),

8.75 (1H, br s), 12.05 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 502 (M⁺), 235 (100).

実施例 8 5 (表中の化合物番号 8 6 6 の化合物)

7 - (ベンゾイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル-3 - ピリジル] ヘプタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブトベンゾイミダゾールを用いて実施例 7 1 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色針状晶として得た。

融点 : 118 - 121 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3 3 9 3, 3 2 1 9, 2 9 6 3, 2 9 2 8,
1 6 6 3, 1 5 5 9, 1 5 2 6, 1 4 3 9.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.29 (6H, d, J = 6.6 Hz), 1.32 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.41 - 1.53 (4H, m), 1.64 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
1.76 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.18 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
3.28 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.56 (1H, sept, J = 6.6 Hz),
3.90 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.93 (1H, s), 7.08 (1H, t, J = 5.9 Hz),
7.09 (1H, t, J = 5.9 Hz), 7.40 (1H, d, J = 5.9 Hz),
7.41 (1H, d, J = 5.9 Hz), 8.86 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 516 (M⁺), 399 (100).

実施例 8 6 (表中の化合物番号 8 6 7 の化合物)

8-(ベンズイミダゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソブロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]オクタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブトベンズイミダゾールを用いて実施例 7 2 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 170 - 171°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3 1 5 8, 2 9 6 3, 2 9 3 0, 1 6 6 5,
1 5 5 9, 1 5 2 6, 1 5 0 8, 1 4 2 9.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ:

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz)
1.32 - 1.50 (6H, m), 1.56 - 1.66 (2H, m),
1.74 (2H, quint, J = 7.3 Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.26 (2H, t, J = 7.3 Hz),
3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.05 - 7.10 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.45 (1H, m),
8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 530 (M⁺), 413 (100).

実施例 8 7 (表中の化合物番号 8 6 8 の化合物)

9 - (ベンズイミダゾール-2-イルチオ) - N - [2, 4-ビス(イソブロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル] ノナンアミドの製造:

2-メルカプトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカプトベンズイミダゾールを用いて実施例 7 3 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄褐色粉末晶として得た。

融点 : 112-114°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3435, 3185, 2927, 1660,
1558, 1526, 1437.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.28 - 1.48 (8H, m), 1.52 - 1.65 (2H, m),
1.73 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.18 - 2.28 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.25 (2H, t, J = 7.1 Hz),
3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.07 (1H, t, J = 6.1 Hz), 7.08 (1H, t, J = 6.1 Hz),
7.32 (1H, d, J = 6.1 Hz), 7.46 (1H, d, J = 6.1 Hz),
8.80 (1H, br s), 12.05 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 544 (M⁺), 151 (100).

実施例 8 8 (表中化合物番号 1 1 4 5 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール-2-イルチオ) - N - [2-メチル-4, 6-ビス(メチルチオ)-5-ピリミジル] ヘキサンアミドの製造:

発煙硝酸 (3 ml) を氷冷し、攪拌しながら 4, 6-ジヒドロキシ-2-メチルピリミジン (1.0 g, 7.9 mmol) を徐々に加えた。氷冷下で 2 時間、室温で 1 時間攪拌後、反応液を氷中に加え、析出した結晶を濾取後乾燥し、4, 6-ジヒドロキシ-2-メチル-5-ニトロピリミジン 207 mg (収率 15 %) を得た。

このニトロピリミジン (205 mg, 1.2 mmol) を塩化ホスホリル (1 ml) に溶解し、ジエチルアニリン (281 mg, 1.9 mmol) を加え、100°Cで1時間、120°Cで1時間攪拌した。反応液を氷中に加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 20 : 1）で精製して、4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ニトロピリミジン 194 mg (収率 77 %) を無色針状晶として得た。

ナトリウムチオメトキシド (780 mg, 10.6 mmol) のメタノール溶液 (10 ml) に、氷冷下で 4, 6-ジクロロ-2-メチル-5-ニトロピリミジン (1.0 g, 4.81 mmol) のメタノール溶液 (10 ml) を滴下し、氷冷下で1時間攪拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた残渣を、酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチル-5-ニトロピリミジン 609 mg (収率 55 %) を得た。

このニトロピリミジン (100 mg, 0.43 mmol) のエタノール (100 ml) 溶液に炭酸カリウム (119 mg, 0.865 mmol)、二酸化白金 (40 mg, 0.18 mmol) を加え、水素雰囲気下で攪拌した。1.5時間後反応混合物を濾過し、濾液を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー（展開溶媒；ヘキサン：酢酸エチル = 6 : 1）で精製して、5-アミノ-4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチルピリミジン 66 mg (収率 76 %) を得た。

3-アミノ-2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに5-アミノ-4, 6-ビス(メチルチオ)-2-メチルピリミジンを用いて実施例18と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 148 - 151°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3440, 3245, 2929, 1660,
1530.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.43 - 1.55 (2H, m), 1.57 - 1.69 (2H, m), 1.72 - 1.84 (2H, m),
2.14 - 2.29 (2H, m), 2.38 (6H, s), 2.48 (3H, m),

3.28 (2H, t, J = 7.3 Hz), 7.21 (1H, td, J = 7.4, 1.7 Hz),
 7.24 (1H, td, J = 7.4, 1.7 Hz), 7.49 (1H, dd, J = 7.4 Hz),
 7.51 (1H, dd, J = 7.4, 1.7 Hz), 8.91 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 448 (M⁺, 100).

実施例 8 9 (表中の化合物番号 1 2 4 7 の化合物)

2-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 9 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 207-209°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3435, 3235, 1673, 1509,
 1433, 1329, 1130.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

2.32 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.48 (3H, s), 4.14 (2H, s),
 6.81 (1H, s), 7.41 (1H, t, J = 7.8 Hz),
 7.52 (1H, d, J = 7.8 Hz), 7.79 (1H, d, J = 7.8 Hz),
 8.46 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 459 (M⁺), 227 (100).

元素分析 : C₁₈H₁₆F₃N₃O₂S₃として

計算値 : C, 47.05; H, 3.51; N, 9.14.

実測値 : C, 46.84; H, 3.66; N, 9.03.

実施例 9 0 (表中の化合物番号 1 2 5 0 の化合物)

2-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例46同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 179 - 180°C.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.75 - 1.87 (2H, m), 1.87 - 2.00 (2H, m),
 2.37 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.30 - 2.39 (2H, m),
 2.43 (3H, s), 3.36 - 3.46 (2H, m), 6.84 (1H, s),
 7.50 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.59 (1H, d, J = 7.9 Hz),
 7.89 (1H, d, J = 7.9 Hz), 8.85 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 501 (M⁺), 200 (100).

実施例91(表中の化合物番号1252の化合物)

7-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例47と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 129 - 131°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3247, 1662, 1505, 1435,
 1337, 1128.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.40 - 1.55 (4H, m), 1.60 - 1.71 (2H, m), 1.80 - 1.89 (2H, m),
 2.20 - 2.34 (2H, m), 2.38 (3H, s), 2.40 (3H, s),
 2.44 (3H, s), 3.37 (2H, t, J = 7.1 Hz), 6.84 (1H, s),
 7.49 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.58 (1H, d, J = 7.8 Hz),
 7.88 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.78 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 529 (M⁺), 200 (100).

実施例 9 2 (表中化合物番号 1 2 5 3 の化合物)

8 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造 :

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブト - 7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 8 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 115 - 116 °C

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.40 - 1.54 (6H, m), 1.56 - 1.72 (2H, m),
 1.85 (2H, quint, J = 7.0 Hz), 2.18 - 2.36 (2H, m),
 2.40 (3H, s), 2.43 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.38 (2H, t, J = 7.3 Hz),
 6.86 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.5 Hz), 7.60 (1H, d, J = 7.5 Hz),
 7.90 (1H, d, J = 7.5 Hz), 8.16 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 543 (M⁺), 200 (100).

実施例 9 3 (表中の化合物番号 1 2 6 0 の化合物)

5 - (5 - クロロ - 7 - イソプロビル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (メチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造 :

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロビル - 2 - メルカブト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 6 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 155 - 156 °C.

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.31 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.72 - 1.85 (2H, m), 1.85 - 1.98 (2H, m),
 2.36 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.32 - 2.40 (2H, m),
 2.43 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.22 (1H, sept, J = 7.1 Hz),

3.31 - 3.42 (2H, m), 6.84 (1H, s), 7.13 (1H, s), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 525 ($M^+ : {}^{37}Cl$), 523 ($M^+ : {}^{35}Cl$), 200 (100).

実施例 9 4 (表中の化合物番号 1 2 6 2 の化合物)

7-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色ブリズム晶として得た。

融点 : 129 - 131°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3413, 3241, 2964, 2924,
1655, 1567, 1505, 1490,
1435, 1149.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.31 (6H, d, J = 7.1 Hz), 1.40 - 1.55 (4H, m), 1.56 - 1.70 (2H, m),
1.83 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.30 (2H, t, J = 7.1 Hz),
2.38 (3H, s), 2.40 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.46 (3H, s),
3.21 (1H, sept, J = 7.1 Hz), 3.34 (2H, t, J = 7.1 Hz),
6.84 (1H, s), 7.14 (1H, s), 8.51 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 553 ($M^+ : {}^{37}Cl$), 551 ($M^+ : {}^{35}Cl$),
200 (100).

実施例 9 5 (表中の化合物番号 1 2 6 3 の化合物)

8-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]オクタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 4 8 と同様に

反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 128 - 131°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3423, 3231, 2929, 1662,
1504, 1489.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.32 (6H, d, J = 7.0 Hz), 1.38 - 1.43 (4H, m),
1.49 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 1.60 - 1.69 (2H, m),
1.84 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.23 - 2.33 (2H, m), 2.40 (3H, s),
2.42 (3H, s), 2.45 (3H, s), 2.47 (3H, s),
3.23 (1H, sept, J = 7.0 Hz), 3.35 (1H, t, J = 7.2 Hz),
6.86 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.78 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 567 (M⁺; ³⁷Cl), 565 (M⁺; ³⁵Cl),
200 (100).

実施例 9 6 (表中の化合物番号 1 2 6 7 の化合物)

2-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチルピリジンを用いて実施例8 9と同様に反応・処理し、目的化合物を無色ブリズム晶として得た。

融点 : 182 - 183°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3435, 3244, 1663, 1508,
1432, 1332.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.16 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.4 Hz), 2.42 (3H, s),
2.81 (2H, q, J = 7.4 Hz), 3.03 (2H, q, J = 7.4 Hz), 4.14 (2H, s),
6.63 (1H, s), 7.40 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.52 (1H, d, J = 7.8 Hz),
7.68 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.34 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 487 (M^+), 235 (100).

元素分析 : C₂₀H₂₀F₃N₃O₂S₃として

計算値 : C, 49.27; H, 4.13; N, 8.62; F, 11.69.

実測値 : C, 49.41; H, 4.20; N, 8.62; F, 11.59.

実施例 9 7 (表中の化合物番号 1 2 6 9 の化合物)

4 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] プantanアミドの製造 :

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブト - 7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 5 7 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 148 - 150 °C

IR (KBr) cm⁻¹: 3439, 3256, 2975, 2929,
1656, 1509, 1433, 1332,
1125.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.23 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz),
2.04 - 2.22 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.47 - 2.48 (2H, m), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.04 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.42 - 3.51 (2H, m), 6.87 (1H, s),
7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz) 7.59 (1H, d, J = 7.8 Hz),
7.89 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.95 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 515 (M^+), 227 (100).

実施例 9 8 (表中化合物番号 1 2 7 0 の化合物)

5 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例58と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 155 - 156°C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.20 - 1.30 (6H, m), 1.73 - 2.05 (4H, m), 2.30 - 2.41 (2H, m),
 2.42 (3H, s), 2.85 - 3.00 (2H, m), 3.01 - 3.09 (2H, m),
 3.37 - 3.48 (2H, m), 6.88 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.5 Hz),
 7.60 (1H, d, J = 7.5 Hz), 7.90 (1H, d, J = 7.5 Hz),
 8.75 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 529 (M⁺), 227 (100).

実施例99(表中の化合物番号1272の化合物)

7-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例59と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 127 - 128°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3448, 1659, 1506, 1336,
 1128, 1116.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.39 - 1.56 (4H, m), 1.56 - 1.72 (2H, m), 1.78 - 1.91 (2H, m),
 2.19 - 2.33 (2H, m), 2.42 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.37 (2H, t, J = 7.2 Hz), 6.86 (1H, s),
 7.49 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.58 (1H, d, J = 7.9 Hz),
 7.88 (1H, d, J = 7.9 Hz), 8.67 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 557 (M⁺), 227 (100).

実施例 100 (表中の化合物番号 1273 の化合物)

8 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブト - 7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 60 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 99 - 100 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3425, 3245, 2923, 1655,
1509, 1433, 1332, 1125.

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz),
1.38 - 1.43 (4H, m), 1.49 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
1.60 - 1.68 (2H, m), 1.85 (2H, quint, J = 7.2 Hz),
2.20 - 2.30 (2H, m), 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz),
3.06 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.38 (2H, t, J = 7.2 Hz),
6.88 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.60 (1H, d, J = 7.8 Hz),
7.90 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.73 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 571 (M⁺), 227 (100).

実施例 101 (表中化合物番号 1274 の化合物)

9 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (エチルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブト - 7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 28 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 115 - 116°C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.2 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.2 Hz),
 1.31 - 1.55 (8H, m), 1.57 - 1.69 (2H, m),
 1.84 (2H, quint, J = 6.9 Hz), 2.18 - 2.34 (2H, m),
 2.43 (3H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.2 Hz), 3.06 (2H, q, J = 7.2 Hz),
 3.37 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.88 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 8.4 Hz),
 7.61 (1H, d, J = 8.4 Hz), 7.90 (1H, d, J = 8.4 Hz),
 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 585 (M⁺), 227 (100).

実施例 102 (表中の化合物番号 1279 の化合物)

4-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 57 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 122 - 123°C.

IR (KBr) cm⁻¹: 3258, 1665, 1502, 1145.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.23 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.15 (2H, t, J = 7.0 Hz), 2.42 (3H, s),
 2.46 (3H, s), 2.47 - 2.50 (2H, m), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.04 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.22 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.43 (2H, t, J = 7.0 Hz), 6.87 (1H, s), 7.14 (1H, s),
 8.83 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 559 (M⁺:³⁷Cl), 557 (M⁺:³⁵Cl),

227 (100).

実施例 103 (表中化合物番号 1280 の化合物)

5-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 58 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点：141-142°C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.25 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.26 (3H, t, J = 7.4 Hz),
 1.32 (6H, d, J = 6.9 Hz), 1.75 - 1.86 (2H, m),
 1.87 - 2.00 (2H, m), 2.30 - 2.40 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 2.45 - 2.52 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.4 Hz),
 3.04 (2H, q, J = 7.4 Hz), 3.23 (1H, sept, J = 6.9 Hz),
 3.33 - 3.43 (2H, m), 6.88 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.82 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 553 (M⁺; ³⁷Cl), 551 (M⁺; ³⁵Cl),
 227 (100).

実施例 104 (表中の化合物番号 1282 の化合物)

7-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 59 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色ブリズム晶として得た。

融点：117-120°C.

IR (KBr) cm⁻¹: 3320, 1668, 1506, 1482,
 1150.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.24 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.25 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.39 - 1.57 (4H, m), 1.57 - 1.71 (2H, m),
 1.77 - 1.89 (2H, m), 2.19 - 2.30 (2H, m), 2.42 (3H, s),
 2.46 (3H, s), 2.92 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.05 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.21 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.33 (2H, t, J = 7.2 Hz),
 6.86 (1H, s), 7.13 (1H, s), 8.66 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 581 (M⁺:³⁷Cl), 579 (M⁺:³⁵Cl),
 227 (100).

実施例 105 (表中の化合物番号 1283 の化合物)

8-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]オクタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 60 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 82-84°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3435, 3259, 2929, 1655,
 1504, 1490.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.26 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.32 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.39 - 1.43 (4H, m),
 1.49 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 1.60 - 1.68 (2H, m),
 1.84 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.22 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 2.47 (3H, s), 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.06 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.22 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.35 (2H, t, J = 7.2 Hz),
 6.88 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 595 (M⁺:³⁷Cl), 593 (M⁺:³⁵Cl),

227 (100).

実施例 106 (表中化合物番号 1284 の化合物)

9-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ノナンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 28 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点：93-94°C

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.28 (3H, t, J = 7.3 Hz),
 1.32 (6H, d, J = 7.0 Hz), 1.29 - 1.55 (8H, m),
 1.56 - 1.69 (2H, m), 1.83 (2H, quint, J = 6.9 Hz),
 2.07 - 2.17 (2H, m), 2.43 (3H, s),
 2.45 - 2.49 (3H, m), 2.94 (2H, q, J = 7.3 Hz),
 3.07 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.22 (1H, sept, J = 7.0 Hz),
 3.34 (2H, t, J = 7.3 Hz), 6.88 (1H, s), 7.15 (1H, s),
 8.73 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 609 (M⁺; ³⁷Cl), 607 (M⁺; ³⁵Cl),

229 (100).

実施例 107 (表中の化合物番号 1287 の化合物)

2-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造：

2-ブロモ-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの代わりに2-ブロモ-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドを用いて実施例 89 と同様に反

に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 121 - 122°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3426, 3210, 2967, 1655,
1507, 1431, 1329.

¹H-NMR (CDC13) δ :

1.17 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.19 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.42 (3H, s),
3.39 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.90 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
4.13 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.41 (1H, t, J = 7.9 Hz),
7.52 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.80 (1H, d, J = 7.9 Hz),
8.30 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 515 (M⁺), 181 (100).

元素分析 : C₂₂H₂₄F₃N₃O₂S₃として

計算値 : C, 51.25; H, 4.69; N, 8.15; F, 11.05.

実測値 : C, 51.28; H, 4.73; N, 8.07; F, 11.02.

実施例 108 (表中の化合物番号 1289 の化合物)

4-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造 :

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 69 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色ブリズム晶として得た。

融点 : 135 - 136°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3446, 3255, 2968, 1660,
1559, 1531, 1504, 1491,
1433, 1139.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz),
2.13 - 2.21 (2H, m), 2.42 (3H, s).

2.47 - 2.50 (2H, m), 3.44 - 3.50 (2H, m),
 3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 6.92 (1H, s), 7.51 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.59 (1H, d, J = 7.8 Hz),
 7.88 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.91 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 543 (M⁺), 207 (100).

実施例 109 (表中の化合物番号 1290 の化合物)

5 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ペンタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブト - 7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 70 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 118 - 120 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3208, 3163, 1663, 1506,
 1431, 1328, 1139.

¹H - N M R (d₆ - DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
 1.73 - 1.87 (2H, m), 1.87 - 2.01 (2H, m), 2.23 - 2.38 (2H, m),
 2.41 (3H, s), 3.41 (2H, t, J = 7.0 Hz), 3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.91 (1H, s), 7.49 (1H, t, J = 7.9 Hz),
 7.58 (1H, d, J = 7.9 Hz), 7.88 (1H, d, J = 7.9 Hz),
 8.67 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 557 (M⁺), 221 (100).

実施例 110 (表中の化合物番号 1291 の化合物)

6 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ヘキサンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例36と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 102 - 103°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3136, 1648, 1507, 1431,
1332, 1129.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.49 - 1.76 (4H, m), 1.77 - 1.94 (2H, m),
2.19 - 2.32 (2H, m), 2.42 (3H, s), 3.38 (2H, t, J = 7.3 Hz),
3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.49 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.58 (1H, d, J = 7.8 Hz),
7.87 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.62 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 571 (M⁺), 235 (100).

実施例111 (表中の化合物番号1292の化合物)

7-(7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾチアゾールを用いて実施例71と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

融点 : 76 - 78°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3423, 3268, 2931, 1660,
1506, 1433, 1334.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.43 - 1.54 (4H, m), 1.61 - 1.69 (2H, m),
1.86 (2H, quint, J = 7.2 Hz), 2.18 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s).

3.39 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.56 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.90 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.93 (1H, s),
 7.51 (1H, dd, J = 8.1, 7.8 Hz), 7.60 (1H, d, J = 7.8 Hz),
 7.90 (1H, d, J = 8.1 Hz), 8.68 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 585 (M⁺), 249 (100).

実施例 1 1 2 (表中の化合物番号 1 2 9 3 の化合物)

8 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 2 - メルカブト - 7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 7 2 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

I R (C a p) cm⁻¹: 3 2 4 6 , 2 9 6 4 , 2 9 3 0 , 1 6 6 4 ,
 1 5 5 9 , 1 5 0 6 , 1 4 3 2 .

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
 1.32 - 1.50 (6H, m), 1.56 - 1.66 (2H, m),
 1.83 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
 2.42 (3H, s), 3.36 (2H, t, J = 7.1 Hz),
 3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 6.91 (1H, s), 7.50 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.59 (1H, d, J = 7.8 Hz),
 7.88 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 599 (M⁺), 263 (100).

実施例 1 1 3 (表中の化合物番号 1 2 9 4 の化合物)

9 - (7 - トリフルオロメチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ビス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] ノナンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールを用いて実施例7-3と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色粉末晶として得た。

融点 : 97 - 98 °C

I R (KBr) cm⁻¹ : 3446, 3266, 2928, 1661,
1560, 1506, 1335, 1127.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.6 Hz), 1.30 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.28 - 1.51 (8H, m), 1.55 - 1.64 (2H, m),
1.83 (2H, quint, J = 7.3 Hz), 2.20 - 2.30 (2H, m),
2.42 (3H, s), 3.36 (2H, t, J = 7.3 Hz),
3.55 (1H, sept, J = 6.6 Hz), 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.91 (1H, s), 7.50 (1H, t, J = 7.8 Hz), 7.59 (1H, d, J = 7.8 Hz),
7.89 (1H, d, J = 7.8 Hz), 8.71 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity) : 613 (M⁺), 277 (100).

実施例114(表中の化合物番号1299の化合物)

4-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ブタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例6-9と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 141 - 143 °C.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.03 - 2.21 (2H, m), 2.42 (3H, s),
2.43 - 2.50 (5H, m), 3.22 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
3.38 - 3.48 (2H, m), 3.55 (1H, sept, J = 6.8 Hz),

3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.92 (1H, s), 7.14 (1H, s),
8.87 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 567 (M⁺:³⁷Cl), 565 (M⁺:³⁵Cl),
207 (100).

実施例 115 (表中の化合物番号 1300 の化合物)

5-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ペンタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 70 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 143-145°C.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.27 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.73 - 1.85 (2H, m), 1.85 - 1.98 (2H, m),
2.25 - 2.37 (2H, m), 2.41 (3H, s),
2.43 - 2.50 (3H, s), 3.21 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
3.37 (2H, t, J = 7.2 Hz), 3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
3.88 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.92 (1H, s), 7.14 (1H, s),
8.76 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 581 (M⁺:³⁷Cl),
579 (M⁺:³⁵Cl, 100).

実施例 116 (表中の化合物番号 1301 の化合物)

6-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘキサンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 5-クロロ-7-イソプロピル

-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例36と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 99 - 101 °C

IR (KBr) cm⁻¹: 3413, 3224, 2964, 1663,
1506, 1148.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.32 (12H, d, J = 6.8 Hz),
1.54 - 1.62 (2H, m), 1.70 (2H, quint, J = 7.1 Hz),
1.87 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.22 - 2.33 (2H, m), 2.43 (3H, s),
2.48 (3H, s), 3.23 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.36 (2H, t, J = 7.1 Hz),
3.57 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.90 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
6.93 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.72 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 595 (M⁺; ³⁷Cl), 593 (M⁺; ³⁵Cl),
518 (100).

実施例117(表中の化合物番号1302の化合物)

7-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]ヘプタンアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチル-2-メルカブトベンゾオキサゾールを用いて実施例71と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 91 - 93 °C

IR (KBr) cm⁻¹: 3436, 3213, 3169, 2962,
2929, 1666, 1505, 1152.

¹H-NMR (d₆-DMSO) δ :

1.29 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz),
1.31 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.40 - 1.52 (4H, m), 1.60 - 1.68 (2H, m),
1.85 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.17 - 2.32 (2H, m), 2.43 (3H, s),

2.47 (3H, s), 3.22 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.35 (2H, t, J = 7.1 Hz),
 3.56 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 3.90 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 6.93 (1H, s), 7.15 (1H, s), 8.67 (1H, br s).
 E I M S m/z (relative intensity): 609 (M⁺; ³⁷Cl), 607 (M⁺; ³⁵Cl),
 532 (100).

実施例 1 1 8 (表中の化合物番号 1 3 0 3 の化合物)

8 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] オクタンアミドの製造:

2 - メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに 5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 2 - メルカブト - 4 - メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例 7 2 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

I R (C a p) cm⁻¹: 3242, 2964, 2928, 1668,
 1559, 1506, 1148.

¹H - N M R (d₆ - D M S O) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.6 Hz), 1.31 (12H, d, J = 6.8 Hz),
 1.32 - 1.50 (6H, m), 1.57 - 1.67 (2H, m),
 1.82 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
 2.42 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.21 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.33 (2H, t, J = 7.1 Hz), 3.55 (1H, sept, J = 6.6 Hz),
 3.89 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 6.91 (1H, s),
 7.14 (1H, s), 8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 623 (M⁺; ³⁷Cl), 621 (M⁺; ³⁵Cl),
 546 (100).

実施例 1 1 9 (表中の化合物番号 1 3 0 4 の化合物)

9 - (5 - クロロ - 7 - イソプロピル - 4 - メチルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリ

ジル] ノナンアミドの製造：

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例73と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色油状物質として得た。

I R (C a p) cm⁻¹: 3 2 4 9, 2 9 6 1, 2 9 2 6, 1 6 6 7,
1 5 6 3, 1 5 0 5.

¹H-N M R (d₆-D M S O) δ :

1.28 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.30 (12H, d, J = 7.1 Hz),
1.28 - 1.50 (8H, m), 1.55 - 1.65 (2H, m),
1.81 (2H, quint, J = 7.1 Hz), 2.17 - 2.27 (2H, m),
2.41 (3H, s), 2.46 (3H, s), 3.21 (1H, sept, J = 7.1 Hz),
3.32 (2H, t, J = 7.1 Hz), 3.54 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
3.89 (1H, sept, J = 7.1 Hz), 6.91 (1H, s),
7.14 (1H, s), 8.65 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 637 (M⁺:³⁷Cl), 635 (M⁺:³⁵Cl) ,
560 (100).

実施例120(表中の化合物番号1317の化合物)

2-(7-メタンスルホニルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造：

2-メルカブト-7-トリフルオロメチルベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-メタンスルホニルベンゾオキサゾールを用いて実施例96と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 159-162°C

I R (K B r) cm⁻¹: 3 4 4 9, 3 2 7 1, 2 9 6 6, 2 9 2 8,
1 6 7 8, 1 5 0 8, 1 3 1 5, 1 1 1 8.

¹H-N M R (C D C l₃) δ :

1.14 (3H, t, J = 7.3 Hz), 1.20 (3H, t, J = 7.3 Hz), 2.43 (3H, s),
2.82 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.01 (2H, q, J = 7.3 Hz), 3.27 (2H, s),

4.15 (2H, s), 6.63 (1H, s), 7.49 (1H, t, J = 7.9 Hz),
 7.83 (1H, dd, J = 7.9, 1.2 Hz), 7.90 (1H, dd, J = 7.9, 1.2 Hz),
 8.17 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 497 (M⁺), 311 (100).

元素分析 : C₂₀H₂₃N₃O₄S₄として

計算値 : C, 48.27; H, 4.66; N, 8.44; S, 25.77...

実測値 : C, 48.36; H, 4.66; N, 8.31; S, 25.76.

実施例 121 (表中の化合物番号 1327 の化合物)

2 - (7 - メタンスルホニルベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - [2, 4 - ピス (イソプロピルチオ) - 6 - メチル - 3 - ピリジル] アセトアミドの製造 :

2 - メルカブトベンゾチアゾールの代わりに 2 - メルカブト - 7 - メタンスルホニルベンゾオキサゾールを用いて実施例 74 と同様に反応・処理し、目的化合物を淡黄色アモルファスとして得た。

I R (KBr) cm⁻¹: 3435, 3337, 2965, 2926,
 1695, 1506, 1424, 1319,
 1117.

¹H - N M R (CDCl₃) δ :

1.16 (6H, d, J = 6.8 Hz), 1.21 (6H, d, J = 6.8 Hz), 2.42 (3H, s),
 3.26 (3H, s), 3.40 (1H, sept, J = 6.8 Hz),
 3.90 (1H, sept, J = 6.8 Hz), 4.15 (2H, s), 6.68 (1H, s),
 7.49 (1H, t, J = 7.9 Hz), 7.83 (1H, dd, J = 7.9, 1.0 Hz),
 7.90 (1H, dd, J = 7.9, 1.0 Hz), 8.11 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 525 (M⁺), 339 (100).

実施例 122 (表中化合物番号 1341 の化合物)

6 - (ベンゾオキサゾール - 2 - イルチオ) - N - (4 - メチル - 2 - メチルチオ - 5 - ピリジル) ヘキサンアミドの製造 :

ナトリウムチオメトキシド (436 mg, 5.9 mmol) のメタノール溶液 (8 ml) に、氷冷下で 2-クロロ-4-メチル-5-ニトロピリジン (2.0 g, 10.4 mmol) のメタノール溶液 (8 ml) を滴下し、室温に昇温して 15 時間搅拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、饱和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、4-メチル-2-メチルチオ-5-ニトロピリジン 1.02 g (收率 98 %) を淡黄色針状晶として得た。

このニトロピリジン (497 mg, 2.7 mmol) を酢酸 (15 ml) と濃塩酸 (0.5 ml) の混合溶媒に懸濁し、氷冷下で亜鉛 (2.12 g, 32.4 mmol) を少量ずつ加えた。氷冷下で 5 分間搅拌し、室温で 30 分間搅拌後反応混合物を滤過し、滤液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、饱和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒：ヘキサン：酢酸エチル = 1 : 1) で精製して、5-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジン 352 mg (收率 85 %) を淡黄色粉末晶として得た。

3-アミノ-2, 4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに 5-アミノ-4-メチル-2-メチルチオピリジンを用いて実施例 18 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 125 - 127 °C

I R (KBr) cm⁻¹: 3433, 3284, 2930, 1654,
1598.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.61 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 1.83 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
1.92 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.19 (3H, s),
2.43 (2H, t, J = 7.4 Hz), 2.54 (3H, s), 3.33 (2H, t, J = 7.4 Hz),
6.92 (1H, br s), 7.03 (1H, s), 7.24 (1H, td, J = 7.7, 1.7 Hz),
7.28 (1H, td, J = 7.7, 1.7 Hz), 7.43 (1H, dd, J = 7.7, 1.7 Hz),
7.57 (1H, dd, J = 7.7, 1.7 Hz), 8.57 (1H, s).

E I M S m/z (relative intensity): 401 (M⁺), 69 (100).

実施例 123 (表中化合物番号 1371 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-(5-メチルチオ-2-ピリジル)ヘキサンアミドの製造:

濃硫酸 (50 ml) を氷冷し、攪拌しながら 30% 過酸化水素水 (25 ml) を滴下した。引き続き 2-アミノ-5-クロロピリジン (5.0 g, 38.9 mmol) の濃硫酸 (50 ml) 溶液を滴下し室温で 48 時間攪拌した。反応液を氷中に加え、析出物を濾取し、得られた残渣をエタノールより再結晶し、5-クロロ-2-ニトロピリジン 4.38 g (収率 71%) を無色粉末晶として得た。

ナトリウムチオメトキシド (1.02 g, 13.9 mmol) のメタノール溶液 (20 ml) に、氷冷下で 5-クロロ-2-ニトロピリジン (2.0 g, 12.6 mmol) のメタノール溶液 (40 ml) を滴下し、室温に昇温して 13 時間攪拌後、反応混合物に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた残渣を、酢酸エチル-ヘキサンより再結晶し、5-メチルチオ-2-ニトロピリジン 972 mg (収率 45%) を得た。

このニトロピリジン (300 mg, 1.8 mmol) を酢酸 (7 ml) と濃塩酸 (0.5 ml) の混合溶媒に懸濁し、氷冷下で亜鉛 (692 mg, 10.6 mmol) を少量ずつ加えた。氷冷下で 5 分間攪拌し、室温で 30 分間攪拌後反応混合物を濾過し、濾液を炭酸水素ナトリウム水溶液で中和し、塩化メチレンで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で順次洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去して得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶媒: ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1 → クロロホルム : メタノール = 20 : 1) で精製して、2-アミノ-5-メチルチオピリジン 158 mg (収率 64%) を淡黄色粉末晶として得た。

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに 2-アミノ-5-メチルチオピリジンを用いて実施例 18 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 83 - 85 °C

IR (KBr) cm⁻¹: 3246, 2930, 1684, 1576,
1522.

¹H - NMR (CDCl₃) δ :

1.59 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 1.81 (2H, quint, J = 7.4 Hz),
 1.90 (2H, quint, J = 7.4 Hz), 2.42 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 2.48 (3H, s), 3.32 (2H, t, J = 7.4 Hz),
 7.23 (1H, td, J = 7.4, 1.4 Hz), 7.28 (1H, td, J = 7.4, 1.4 Hz),
 7.43 (1H, dd, J = 7.4, 1.4 Hz), 7.59 (1H, dd, J = 7.4, 1.4 Hz),
 7.64 (1H, dd, J = 8.6, 2.5 Hz), 7.82 (1H, br s),
 8.15 (1H, d, J = 8.6 Hz), 8.18 (1H, d, J = 2.5 Hz).

EIMS m/z (relative intensity): 387 (M⁺, 100).

実施例 124 (表中化合物番号 1401 の化合物)

6-(ベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2, 4, 6-トリス(メチルチオ)-5-ピリミジル]ヘキサンアミドの製造:

4, 6-ジヒドロキシ-2-メチルピリミジンの代わりに4, 6-ジヒドロキシ-2-メチルチオピリミジンを用いて実施例 88 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

融点 : 149 - 153°C

IR (KBr) cm⁻¹: 3448, 3247, 2926, 1667,
 1496.

¹H - NMR (CDCl₃) δ :

1.46 - 1.62 (2H, m), 1.63 - 1.76 (2H, m), 1.77 - 1.91 (2H, m),
 2.20 - 2.36 (2H, m), 2.46 (9H, s), 3.36 (2H, t, J = 7.1 Hz),
 7.22 - 7.35 (2H, m), 7.51 - 7.62 (2H, m), 9.02 (1H, br s).

EIMS m/z (relative intensity): 480 (M⁺, 100).

実施例 125 (表中の化合物番号 1427 の化合物)

2-(7-メトキシカルボニルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2, 4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカブトベンゾオキサゾールの代わりに2-メルカブト-7-メトキシカルボニルベンゾオキサゾールを用いて実施例26と同様に反応・処理し、目的化合物を無色針状晶として得た。

融点 : 168-169°C

I R (KBr) cm⁻¹: 3433, 3257, 1727, 1677,
1513, 1297, 1120.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.16 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.19 (3H, t, J = 7.4 Hz), 2.42 (3H, s),
2.80 (2H, q, J = 7.4 Hz), 3.03 (2H, q, J = 7.4 Hz), 4.00 (3H, s),
4.12 (2H, s), 6.63 (1H, s), 7.38 (1H, dd, J = 8.1, 7.8 Hz),
7.80 (1H, dd, J = 8.1, 1.2 Hz), 7.92 (1H, dd, J = 7.8, 1.2 Hz),
8.48 (1H, br s).

E I M S m/z (relative intensity): 477 (M⁺), 323 (100).

元素分析 : C₂₁H₂₃N₃O₄S₃として

計算値 : C, 52.81; H, 4.85; N, 8.80; S, 20.14.

実測値 : C, 52.90; H, 4.91; N, 8.73; S, 20.12.

実施例126(表中の化合物番号1428の化合物)

2-(オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカブトベンゾチアゾールの代わりに2-メルカブトオキサゾロ[4,5-b]ピリジンを用いて実施例49と同様に反応・処理し、目的化合物を無色結晶として得た。

I R (KBr) cm⁻¹: 3460, 3167, 2972, 1685,
1561.

¹H-NMR (CDCl₃) δ :

1.14 (3H, t, J = 7.4 Hz), 1.21 (3H, t, J = 7.4 Hz),
2.42 (3H, s), 2.82 (2H, q, J = 7.4 Hz),
3.02 (2H, q, J = 7.4 Hz), 4.16 (2H, s), 6.62 (1H, s),

7.25 (1H, dd, J = 8.3, 5.1 Hz), 7.78 (1H, dd, J = 8.3, 1.2 Hz),
8.40 (1H, br s), 8.49 (1H, dd, J = 5.1, 1.2 Hz).

E I M S m/z (relative intensity): 420 (M⁺, 100).

実施例 127 (表中の化合物番号 1257 の化合物)

2-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

2-メルカブトベンゾチアゾールの代わりに5-クロロ-7-イソプロピル-2-メルカブト-4-メチルベンゾオキサゾールを用いて実施例49と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

E I M S m/z (relative intensity): 481 (M⁺), 210 (100).

実施例 128 (表中の化合物番号 1277 の化合物)

2-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-2,4-ビス(エチルチオ)-6-メチルピリジンを用いて実施例127と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

E I M S m/z (relative intensity): 511 (M⁺; ³⁷Cl), 509 (M⁺; ³⁵Cl),
235 (100).

実施例 129 (表中の化合物番号 1297 の化合物)

2-(5-クロロ-7-イソプロピル-4-メチルベンゾオキサゾール-2-イルチオ)-N-[2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチル-3-ピリジル]アセトアミドの製造:

3-アミノ-2,4-ビス(メチルチオ)-6-メチルピリジンの代わりに3-アミノ-2,4-ビス(イソプロピルチオ)-6-メチルピリジンを用いて実

施例 127 と同様に反応・処理し、目的化合物を無色粉末晶として得た。

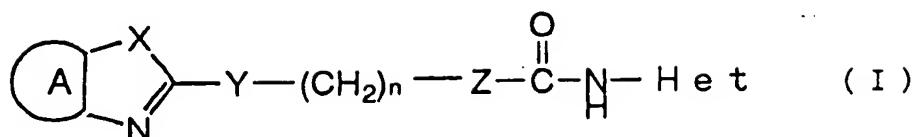
E I M S m/z (relative intensity): 539 (M^+ ; ^{37}Cl), 537 (M^+ ; ^{35}Cl),
223 (100).

産業上の利用性

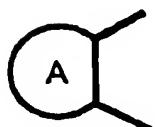
本発明は、新規アミド化合物及びこれを含有する医薬を提供し、より詳細には、前記一般式 (I) で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物及びこれらの化合物からなる医薬組成物を提供する

請求の範囲

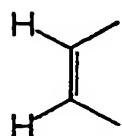
1. 一般式 (I)



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン、ピリジン、シクロヘキサン、又はナフタレンの2価残基、又は、基



を示し、

H e t は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群から選ばれる少なくとも1個の異種原子を含有する5～8員の置換又は非置換の単環式、多環式又は縮合環式の複素環を示し、

X は、 $-NH-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、 $-NR_{4-}$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は $-NR_{5-}$ を示し、

R₁ は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよい

シリル低級アルキル基を示し、

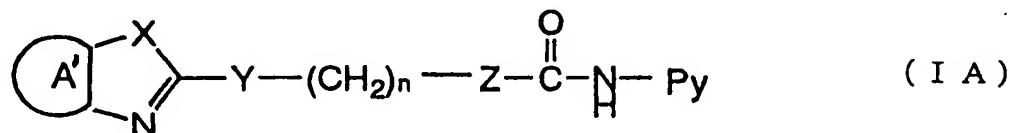
R_s は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよい
シリル低級アルキル基を示し、

n は、1乃至15の整数を示す。)

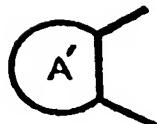
で表される化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

2. 前記一般式(I)中のHettが、置換又は非置換のピリジル基又はピリミジル基である請求の範囲第1項に記載の化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

3. 一般式(IA)、



(式中、



は、置換基を有していてもよいベンゼン又はピリジンの2価残基を示し、

Py は、置換基を有していてもよいピリジル基又はピリミジル基を示し、

X は、 $-\text{NH}-$ 、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Y は、 $-\text{NR}_1-$ 、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Z は、単結合又は $-\text{NR}_2-$ を示し、

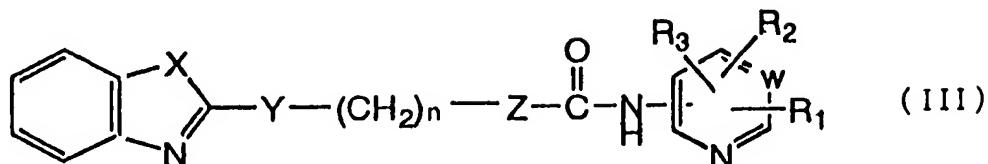
R_1 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよい
シリル低級アルキル基を示し、

R_2 は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよい
シリル低級アルキル基を示し、

nは、1乃至15の整数を示す。)

で表される請求の範囲第1項又は2項に記載の化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

4. 一般式 (III)



(式中、Wは、=CH-、又は、=N-を示し、

Xは、-NH-、酸素原子又は硫黄原子を示し、

Yは、-NR₄-、酸素原子、硫黄原子、スルホキシド又はスルホンを示し、

Zは、単結合又は-NR₅-を示し、

R₁、R₂及びR₃は、同一又は異なって、水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子、水酸基、リン酸基、スルホンアミド基、低級アルキチオ基、置換基を有していてもよいアミノ基、又は、R₁、R₂、R₃のいずれか2個が一緒になってアルキレンジオキシ基を示し、

R₄は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

R₅は、水素原子、低級アルキル基、アリール基又は置換基を有していてもよいシリル低級アルキル基を示し、

nは、1乃至15の整数を示す。)

で表される請求の範囲第1項、2項又は3項に記載の化合物、これらの塩又はこれらの溶媒和物。

5. 請求の範囲第1項、2項、3項又は第4項の何れかに記載された化合物、その塩又は溶媒和物からなる少なくとも1種の化合物及び製薬上許容される担体とからなる医薬組成物。

6. ACAT阻害剤、細胞内コレステロール輸送阻害剤、血中コレステロール低

下剤、又はマクロファージ泡沫化抑制剤である請求の範囲第5項に記載の医薬組成物。

7. 高脂血症、動脈硬化症、脳血管障害、虚血性心疾患、虚血性腸疾患、大動脈瘤の予防、治療剤である請求の範囲第5項又は第6項に記載の医薬組成物。

8. 請求の範囲第1項、2項、3項又は第4項の何れかに記載された化合物、その塩又は溶媒和物の少なくとも1種の化合物を含有してなるACAT阻害剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/05149

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁶ C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, A61K31/44, A61K31/505

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁶ C07D403/12, C07D413/12, C07D417/12, A61K31/44, A61K31/505

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	JP, 4-139172, A (Sankyo Co., Ltd.), 13 May, 1992 (13. 05. 92) (Family: none)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis of some new aryl- and aralkylthiobenzoxazoles, -benzimidazoles and -benzothiazoles of potential biological interest", Gazz. Chim. Ital., Vol. 112, No. 1-2, p.55-56 (1982)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis and biological activities of some new 2-(N-heterocyclic carboxamidomethyl thio) benzoxazoles, benzthiazoles and benzimidazoles. Part VIII", Eur. J. Med. Chem.-Chim. Ther., Vol. 16, NO. 4, p.383-384 (1981)	1-5 6-8
X A	ABDEL Rahman, A.E. et al., "Synthesis and biological activities of some new 2-(N-heterocyclocarboxamidomethylthio)naphth[1,2-d]oxazoles. Part VI", J. Indian Chem. Soc., Vol. 58, No. 2, p.171-173 (1981)	1, 2, 5 3, 4, 6-8

Further documents are listed in the continuation of Box C. See patent family annex.

* Special categories of cited documents:

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
8 February, 1998 (08. 02. 98)

Date of mailing of the international search report
16 February, 1999 (16. 02. 99)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP98/05149

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	EL-EZBAWY, S.R. et al., "Synthesis and antibacterial activity of some new pyridyl diaryl sulfide and diaryl sulfones", Phosphorus, Sulfur Silicon Relat. Elemt., Vol. 48, No. 1-4, p.111-116 (1990)	1, 2, 5 3, 4, 6-8
X A	TURAN-ZITOUNI, G. et al., "Synthesis of some 5-methoxy-3-[(benzazole-2-yl)thioacetylamino]-2,3-dihydrobenzofuran derivatives and investigation of their antihypertensive activities", Ann. Pharm. Fr., Vol. 54, No. 3, p.109-111 (1996)	1, 5 2-4, 6-8
X A	TRIVEDI, Bhavin et al., "Synthesis and antimicrobial activity of 2-aryl-3-(benzothiazol-2'-yl-thioacetamido)-5-H/methyl/carboxymethyl-4-thiazolidinones", Proc.- Indian Acad. Sci., Chem. Sci., Vol. 104, No. 4, p.489-496 (1992)	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 62-42989, A (Sumitomo Pharmaceuticals Co., Ltd.), 24 February, 1987 (24. 02. 87) & JP, 56-30987, A & CA, 1152980, A & IT, 1146168, B	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 51-16433, B (Fujisawa Pharmaceutical Co., Ltd.), 24 May, 1976 (24. 05. 76), Examples 1, 7 & JP, 54-34758, B	1, 5 2-4, 6-8
PA	JP, 10029986, A (Kowa Co., Ltd.), 3 February, 1998 (03. 02. 98) & EP, 807627, A2	1-8

国際調査報告

国際出願番号 PCT/JP98/05149

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. Cl° C07D 403/12, C07D 413/12, C07D 417/12, A61K 31/44,
A61K 31/505

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. Cl° C07D 403/12, C07D 413/12, C07D 417/12, A61K 31/44,
A61K 31/505

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CA (STN), CAOLD (STN), CAPLUS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	JP, 4-139172, A (三共株式会社) 13.5月. 1992 (13.05.92) (ファミリーなし)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis of some new aryl- and aralkylthiobenzoxazoles, -benzimidazoles and -benzothiazoles of potential biological interest", Gazz. Chim. Ital., Vol. 112, No. 1-2, p. 55-56 (1982)	1-5 6-8
X A	MAHMOUD, Abdalla M. et al., "Synthesis and biological activities of some new 2-(N-heterocyclic carboxamidomethyl thio) benzoxazoles, benzthiazoles and benzimidazoles. Part VIII", Eur. J. Med. Chem. - Chim. Ther., Vol. 16, No. 4, p. 383-384 (1981)	1-5 6-8

 C欄の続きにも文献が列挙されている。 パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
- 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「I」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す)
- 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献
 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
 「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

08. 02. 98

国際調査報告の発送日

16.02.99

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官(権限のある職員)

浅見 節子

4C 9638

電話番号 03-3581-1101 内線 3454

C (続き) 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	ABDEL Rahman, A. E. et al., "Synthesis and biological activities of some new 2-(N-heterocyclocarboxamidomethylthio)naphth[1,2-d]oxazoles. Part VI", J. Indian Chem. Soc., Vol. 58, No. 2, p. 171-173 (1981)	1, 2, 5 3, 4, 6-8
X A	EL-EZBAWY, S. R. et al., "Synthesis and antibacterial activity of some new pyridyl diaryl sulfide and diaryl sulfones", Phosphorus, Sulfur Silicon Relat. Elel., Vol. 48, No. 1-4, p. 111-116(1990)	1, 2, 5 3, 4, 6-8
X A	TURAN-ZITOUNI, G. et al., "Synthesis of some 5-methoxy-3-[(benzazole-2-yl)thioacetylarnino]-2,3-dihydrobenzofuran derivatives and investigation of their antihypertensive activities", Ann. Pharm. Fr., Vol. 54, No. 3, p. 109-111 (1996)	1, 5 2-4, 6-8
X A	TRIVEDI, Bhavin et al., "Synthesis and antimicrobial activity of 2-aryl-3-(benzothiazol-2'-yl-thioacetamido)-5-H/methyl/carboxymethyl-4-thiazolidinones", Proc. - Indian Acad. Sci., Chem. Sci., Vol. 104, No. 4, p. 489-496 (1992)	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 62-42989, A (住友製薬株式会社) 24. 2月. 1987 (24. 02. 87) &JP, 56-30987, A &CA, 1152980, A &IT, 1146168, B	1, 5 2-4, 6-8
X A	JP, 51-16433, B (藤沢薬品工業株式会社) 24. 5月. 1976 (24. 05. 76) 実施例 1 及び 7 &JP, 54-34758, B	1, 5 2-4, 6-8
PA	JP, 10029986, A (興和株式会社) 3. 2月. 1998 (03. 02. 98) &EP, 807627, A2	1-8